

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND



Prioritätsbescheinigung DE 197 01 446.1 über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen: 197 01 446.1

Anmeldetag: 17. Januar 1997

Anmelder/Inhaber: BASF AG, 67063 Ludwigshafen/DE

Bezeichnung: 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate

IPC: C 07 D 413/10, C 07 D 417/20, C 077 D 403/00,
C 07 D 498/10, A 01 N 43/56, A 01 N 43/74,
A 01 N 43/90

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der am 17. Januar 1997 eingereichten Unterlagen dieser Patentanmeldung, hinterlegt mit dem Prioritätsbeleg vom 10. November 1997 bei der Europäischen Patentamt.

München, den 28. April 2010
Deutsches Patent- und Markenamt
Die Präsidentin
Im Auftrag

Riester



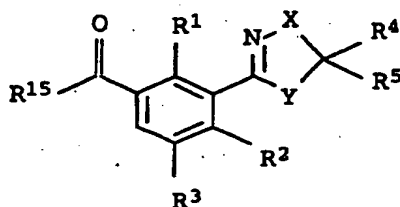
3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate

Zusammenfassung

5

Die Erfindung betrifft Benzoylderivate der Formel I

10



I

15

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

- 20 R^1, R^2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylsulfinyl, Halogenalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder C_1-C_6 -Halogenalkylsulfonyl;
- 25 R^3 Wasserstoff, Halogen oder Alkyl;
- R^4, R^5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Dialkylamino, Phenyl oder Carbonyl, wobei die 6 letztgenannten Reste substituiert sein können;
- 30 X O, S, NR^9 , CO oder $CR^{10}R^{11}$;
- Y O, S, NR^{12} , CO oder $CR^{13}R^{14}$;
- 35 R^{15} gegebenenfalls substituiertes in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol, das in 5-Stellung einen Hydroxy- oder Sulfonyloxy-Rest trägt;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung der 3-Heterocycl-yl-substituier-

40 ten Benzoylderivate; Mittel welche diese enthalten; sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltenden Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 000190

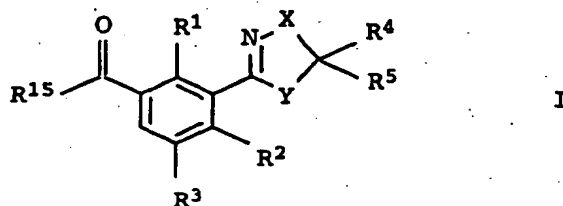
3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

10



15

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

20 R¹, R²

Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

25

R³

Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

R⁴, R⁵

30

Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

35

40

oder

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

2

R^4 und R^5 bilden gemeinsam eine C_2-C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1-C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

5

oder

R^4 und R^5 bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

10

R^6 C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkoxy- C_2-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -Halogenalkoxy, C_3-C_6 -Alkenyloxy, C_3-C_6 -Alkinyloxy oder NR^7R^8 ;

15

R^7 Wasserstoff oder C_1-C_4 -Alkyl;

R^8 C_1-C_4 -Alkyl;

20 X

O, S, NR^9 , CO oder $CR^{10}R^{11}$;

Y

O, S, NR^{12} , CO oder $CR^{13}R^{14}$;

R^9 , R^{12} Wasserstoff oder C_1-C_4 -Alkyl;

25

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} Wasserstoff, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl, C_1-C_4 -Halogenalkoxycarbonyl oder $CONR^7R^8$;

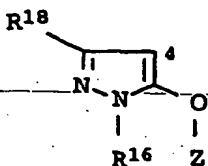
30 oder

R^4 und R^9 oder R^4 und R^{10} oder R^5 und R^{12} oder R^5 und R^{13} bilden gemeinsam eine C_2-C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1-C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

35

R^{15} ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der Formel II

40



II

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

3

wobei

R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl;5 Z H oder SO₂R¹⁷;

10 R¹⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, Phenyl oder Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

15 R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl

bedeuten;

wobei X und Y nicht gleichzeitig für Sauerstoff oder Schwefel stehen;

20

und

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,
25 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und
30 4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

35 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltende Mittel zur Schädnpflanzenbekämpfung.

40 Aus der Literatur, beispielsweise aus WO 96/26206 sind Pyrazol-4-yl-benzoylderivate bekannt.

Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen sowie die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können je-
45 doch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung die

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 08.01.98

4

Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Verbindungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

Demgemäß wurden die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate 5 der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur 10 Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als 15 Enantiomeren oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirt- 20 schaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchti- 25 gen.

Es kommen als Kationen, insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, 30 vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C₁-C₄-Alkyl oder Hydroxy-C₁-C₄-alkyl und/oder ein Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethyl- 35 benzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie 40 Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

5

Die für die Substituenten R^1 - R^{18} oder als Reste an Phenylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Halogen-

- 5 alkyl-, Cyanoalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkyliminoxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Halogenalkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, Alkoxy-carbonyl-, Halogenalkoxycarbonyl, Alkenyloxy-, Alkinyloxy-, Dialkylamino-, Dialkylhydrazino-, Alkoxyalkyl-, Dialkoxyalkyl-, 10 Alkylthioalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Dialkylhydrazinoalkyl-, Alkyliminoxyalkyl-, Alkoxy-carbonylalkyl- und Alkoxyalkoxy-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung 15 Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

Ferner bedeuten beispielsweise:

- 20 C_1 - C_4 -Alkyl: sowie die Alkylteile von Di- (C_1 - C_4 -alkoxy)- C_1 - C_4 -alkyl, [2,2-Di- (C_1 - C_4 -alkyl)-hydrazino-1]- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkyliminoxy- C_1 - C_4 -alkyl: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- 25 C_1 - C_6 -Alkyl: C_1 - C_4 -Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 30 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Tri-methylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methyl-propyl;
- 35 C_1 - C_4 -Halogenalkyl: einen C_1 - C_4 -Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor- 40 difluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluor-ethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlor- 45 propyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluor-

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 05.01.98

6

methyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl und Nonafluorbutyl;

- 5 - C₁-C₆-Halogenalkyl: C₁-C₄-Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Dodecafluorhexyl;
- 10 - C₁-C₄-Cyanoalkyl: z.B. Cyanomethyl, 1-Cyanoeth-1-yl, 2-Cyanoeth-1-yl, 1-Cyanoprop-1-yl, 2-Cyanoprop-1-yl, 3-Cyanoprop-1-yl, 1-Cyanoprop-2-yl, 2-Cyanoprop-2-yl, 1-Cyanobut-1-yl, 2-Cyanobut-1-yl, 3-Cyanobut-1-yl, 4-Cyanobut-1-yl, 1-Cyanobut-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl, 1-Cyanobut-3-yl, 2-Cyanobut-3-yl, 1-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 2-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl und 2-Cyanomethyl-prop-2-yl;
- 20 - C₁-C₄-Alkoxy: sowie die Alkoxyteile von Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;
- 25 - C₁-C₆-Alkoxy: C₁-C₄-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methoxybutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 35 - C₁-C₄-Halogenalkoxy: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy,
- 40
- 45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

7

1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;

- 5 - C₁-C₆-Halogenalkoxy: C₁-C₄-Halogenalkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy und Dodecafluorhexoxy;

10

- C₁-C₆-Alkyliminooxy: sowie die C₁-C₆-Alkyliminooxyteile von C₁-C₆-Alkyliminooxy-C₁-C₄-alkyl, z.B. Methyliminooxy, Ethyliminooxy, 1-Propyliminooxy, 2-Propyliminooxy, 1-Butyliminooxy, 2-Butyliminooxy, 2-Methyl-prop-1-yliminooxy, 1-Pentyliminooxy, 2-Pentyliminooxy, 3-Pentyliminooxy, 3-Methyl-but-2-yliminooxy, 2-Methyl-but-1-yliminooxy, 3-Methyl-but-1-yliminooxy, 1-Hexyliminooxy, 2-Hexyliminooxy, 3-Hexyliminooxy, 2-Methyl-pent-1-yliminooxy, 3-Methyl-pent-1-yliminooxy, 4-Methyl-pent-1-yliminooxy, 2-Ethyl-but-1-yliminooxy, 3-Ethyl-but-1-yliminooxy, 2,3-Dimethyl-but-1-yliminooxy, 3-Methyl-pent-2-yliminooxy, 4-Methyl-pent-2-yliminooxy und 3,3-Dimethyl-but-2-yliminooxy;

20

- C₁-C₄-Alkylthio: z.B. Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;

25

- C₁-C₆-Alkylthio: C₁-C₄-Alkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio und 1-Ethyl-2-methylpropylthio;

35

- 40 - C₁-C₄-Halogenalkylthio: einen C₁-C₄-Alkylthioest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-di-

45

11 08 01 99

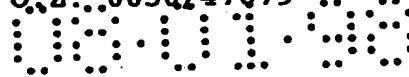
8

- fluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio, 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio, Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio, 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio und Nonafluorbutylthio;
- C₁-C₆-Halogenalkylthio: C₁-C₄-Halogenalkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentylthio, 5-Chlorpentylthio, 5-Brompentylthio, 5-Iodpentylthio, Undecafluorpentylthio, 6-Fluorhexylthio, 6-Chlorhexylthio, 6-Bromhexylthio, 6-Iodhexylthio und Dodecafluorhexylthio;
- C₁-C₆-Alkylsulfinyl (C₁-C₆-Alkyl-S(=O)-): z.B. Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylethylsulfinyl, Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl, 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl, Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl, 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl, 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl, 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl, 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl, 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl;
- C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl: C₁-C₆-Alkylsulfinylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl, Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl, 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl, 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl, 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl, 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl, 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluor-

M 000199

9

- propylsulfinyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl, 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl, Nonafluorbutylsulfinyl, 5-Fluorpentylsulfinyl, 5-Chlorpentylsulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl, 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluorpentylsulfinyl, 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl, 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl und Dodecafluorhexylsulfinyl;
- C_1-C_6 -Alkylsulfonyl (C_1-C_6 -Alkyl-S(=O)₂-): z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl, Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- C_1-C_6 -Halogenalkylsulfonyl: einen C_1-C_6 -Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl,



10

nyl, Nonafluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und Dodecafluorhexylsulfonyl;

5

- C₁-C₄-Alkoxycarbonyl: z.B. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl und 1,1-Dimethoxycarbonyl;

10

- C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl: einen C₁-C₄-Alkoxycarbonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxycarbonyl, Difluormethoxycarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, Chlordifluormethoxycarbonyl, Bromdifluormethoxycarbonyl, 2-Fluorethoxycarbonyl, 2-Chlorethoxycarbonyl, 2-Bromethoxycarbonyl, 2-Iodethoxycarbonyl, 2,2-Difluorethoxycarbonyl, 2,2,2-Trifluorethoxycarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethoxycarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethoxycarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxycarbonyl, 2,2,2-Trichlorethoxycarbonyl, Pentafluorethoxycarbonyl, 2-Fluorpropoxycarbonyl, 3-Fluorpropoxycarbonyl, 2-Chlorpropoxycarbonyl, 3-Chlorpropoxycarbonyl, 2-Brompropoxycarbonyl, 3-Brompropoxycarbonyl, 2,2-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Dichlorpropoxycarbonyl, 3,3,3-Trifluorpropoxycarbonyl, 3,3,3-Trichlorpropoxycarbonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxycarbonyl, Heptafluorpropoxycarbonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxycarbonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxycarbonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxycarbonyl, 4-Fluorbutoxycarbonyl, 4-Chlorbutoxycarbonyl, 4-Brombutoxycarbonyl und 4-Iodbutoxycarbonyl;

30

35

40

45

- C₃-C₆-Alkenyloxy: z.B. Prop-1-en-1-yloxy, Prop-2-en-1-yloxy, 1-Methylethenyloxy, Buten-1-yloxy, Buten-2-yloxy, Buten-3-yloxy, 1-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, Penten-1-yloxy, Penten-2-yloxy, Penten-3-yloxy, Penten-4-yloxy, 1-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yloxy, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yloxy, Hex-1-en-1-yloxy, Hex-2-en-1-yloxy, Hex-3-en-1-yloxy, Hex-4-en-1-yloxy, Hex-5-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-1-en-1-yloxy,

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

11 08.01.99

11

- 4-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yloxy und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yloxy;
- C₃-C₆-Alkinyloxy: z.B. Prop-1-in-1-yloxy, Prop-2-in-1-yloxy, But-1-in-1-yloxy, But-1-in-3-yloxy, But-1-in-4-yloxy, But-2-in-1-yloxy, Pent-1-in-1-yloxy, Pent-1-in-3-yloxy, Pent-1-in-4-yloxy, Pent-1-in-5-yloxy, Pent-2-in-1-yloxy, Pent-2-in-4-yloxy, Pent-2-in-5-yloxy, 3-Methyl-but-1-in-3-yloxy, 3-Methyl-but-1-in-4-yloxy, Hex-1-in-1-yloxy, Hex-1-in-3-yloxy, Hex-1-in-4-yloxy, Hex-1-in-5-yloxy, Hex-1-in-6-yloxy, Hex-2-in-1-yloxy, Hex-2-in-4-yloxy, Hex-2-in-5-yloxy, Hex-2-in-6-yloxy, Hex-3-in-1-yloxy, Hex-3-in-2-yloxy, 3-Methylpent-1-in-1-yloxy, 3-Methylpent-1-in-3-yloxy, 3-Methylpent-1-in-4-yloxy, 3-Methylpent-1-in-5-yloxy, 4-Methylpent-1-in-1-yloxy, 4-Methylpent-2-in-4-yloxy und 4-Methylpent-2-in-5-yloxy;
- Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino: z.B. N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino, N,N-Dipropylamino, N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino, N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino,

12 000100

12

5 N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;

10

15 [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1], sowie die Dialkylhydrazino-Teile von [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl: z.B. 2,2-Dimethylhydrazino-1, 2,2-Diethylhydrazino-1, 2,2-Dipropylhydrazino-1, 2,2-Di-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2,2-Di-butylhydrazino-1, 2,2-Di-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2,2-Di-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2,2-Di-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-methylhydrazino-1, 2-Methyl-2-propylhydrazino-1, 2-Methyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-methylhydrazino-1, 2-Methyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Methyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-methylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-propylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-ethylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylethyl)-2-propylhydrazino-1, 2-Butyl-2-propylhydrazino-1, 2-(1-Methylpropyl)-2-propylhydrazino-1, 2-(2-Methylpropyl)-2-propylhydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-propylhydrazino-1, 2-Butyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylethyl)-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylethyl)-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylpropyl)-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1 und 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1;

35

40 Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl: durch Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino wie voranstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. N,N-Dimethylaminomethyl, N,N-Diethylaminomethyl, N,N-Dipropylaminomethyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminomethyl, N,N-Dibutylaminomethyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminomethyl, N,N-Di-(2-methylpropyl)aminomethyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-propylaminomethyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl,

45

H 000100

13

- 5 N-Butyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-(1-methyl-propyl)aminomethyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminomethyl, N-Ethyl-N-propylaminomethyl, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-ethylaminomethyl, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-propylaminomethyl, N-Butyl-N-propylaminomethyl, N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminomethyl, N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminomethyl,
- 10 N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylaminomethyl, N-Butyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, 2-(N,N-Dimethylamino)-ethyl, 2-(N,N-Diethylamino)ethyl, 2-(N,N-Dipropylamino)-ethyl, 2-[N,N-Di-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N,N-Dibutylamino]ethyl, 2-[N,N-Di-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N,N-Di-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N,N-Di-(1,1-Dimethylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-methylamino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-methylamino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-ethylamino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methylethyl)-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino]ethyl, 2-[N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(1-methyl-ethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(1,1-Dimethylethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 3-(N,N-Dimethyl-
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40
- 45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 08.01.90

14

amino)propyl, 3-(N,N-Diethylamino)propyl, 4-(N,N-Dimethylamino)butyl und 4-(N,N-Diethylamino)butyl;

- 5 - C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, (1-Methylethoxy)methyl, Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, (1,1-Dimethylethoxy)methyl, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)propyl, 3-(Propoxy)propyl, 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl, 4-(Ethoxy)butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl und 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl;
- 10
- 15
- 20
- 25
- 30 - C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Propylthiomethyl, (1-Methylethylthio)methyl, Butylthiomethyl, (1-Methylpropylthio)methyl, (2-Methylpropylthio)methyl, (1,1-Dimethylethylthio)methyl, 2-Methylthioethyl, 2-Ethylthioethyl, 2-(Propylthio)ethyl, 2-(1-Methylethylthio)ethyl, 2-(Butylthio)ethyl, 2-(1-Methylpropylthio)ethyl, 2-(2-Methylpropylthio)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)ethyl, 2-(Methylthio)propyl, 3-(Methylthio)propyl, 2-(Ethylthio)propyl, 3-(Ethylthio)propyl, 3-(Propylthio)propyl, 3-(Butylthio)propyl, 4-(Methylthio)butyl, 4-(Ethylthio)butyl, 4-(Propylthio)butyl und 4-(Butylthio)butyl;
- 35
- 40
- 45 - C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, Propoxycarbonylmethyl, (1-Methylethoxycarbonyl)methyl, Butoxycarbonylmethyl, (1-Methylpropoxycarbonyl)methyl, (2-Methyl-

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

14 08 01 99

15

- propoxycarbonyl)methyl, (1,1-Dimethylethoxycarbonyl)methyl,
 2-(Methoxycarbonyl)ethyl, 2-(Ethoxycarbonyl)ethyl, 2-(Prop-
 oxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)ethyl,
 2-(Butoxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethyl,
 5 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy-
 carbonyl)ethyl, 2-(Methoxycarbonyl)propyl, 2-(Ethoxy-
 carbonyl)propyl, 2-(Propoxycarbonyl)propyl, 2-(1-Methyl-
 ethoxycarbonyl)propyl, 2-(Butoxycarbonyl)propyl, 2-(1-Methyl-
 propoxycarbonyl)propyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
 10 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl, 3-(Methoxycarbonyl)-
 propyl, 3-(Ethoxycarbonyl)propyl, 3-(Propoxycarbonyl)propyl,
 3-(1-Methylethoxycarbonyl)propyl, 3-(Butoxycarbonyl)propyl,
 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propyl, 3-(2-Methylpropoxy-
 carbonyl)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl,
 15 2-(Methoxycarbonyl)butyl, 2-(Ethoxycarbonyl)butyl, 2-(Prop-
 oxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl,
 2-(Butoxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy-
 carbonyl)butyl, 3-(Methoxycarbonyl)butyl, 3-(Ethoxy-
 carbonyl)butyl, 3-(Propoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylethoxy-
 carbonyl)butyl, 3-(Butoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylpropoxy-
 carbonyl)butyl, 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
 20 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl, 4-(Methoxycarbonyl)-
 butyl, 4-(Ethoxycarbonyl)butyl, 4-(Propoxycarbonyl)butyl,
 25 4-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl, 4-(Butoxycarbonyl)butyl,
 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy und
 4-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl;
- C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy: durch C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend
 30 genannt substituiertes C₂-C₄-Alkoxy, also z.B. für
 2-(Methoxy)ethoxy, 2-(Ethoxy)ethoxy, 2-(Propoxy)ethoxy,
 2-(1-Methylethoxy)ethoxy, 2-(Butoxy)ethoxy, 2-(1-Methyl-
 propoxy)ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(1,1-Dimethyl-
 ethoxy)ethoxy, 2-(Methoxy)propoxy, 2-(Ethoxy)propoxy,
 35 2-(Propoxy)propoxy, 2-(1-Methylethoxy)propoxy,
 2-(Butoxy)propoxy, 2-(1-Methylpropoxy)propoxy, 2-(2-Methyl-
 propoxy)propoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 3-(Methoxy)-
 propoxy, 3-(Ethoxy)propoxy, 3-(Propoxy)propoxy, 3-(1-Methyl-
 ethoxy)propoxy, 3-(Butoxy)propoxy, 3-(1-Methyl-
 40 propoxy)propoxy, 3-(2-Methylpropoxy)propoxy, 3-(1,1-Dimethyl-
 ethoxy)propoxy, 2-(Methoxy)butoxy, 2-(Ethoxy)butoxy,
 2-(Propoxy)butoxy, 2-(1-Methylethoxy)butoxy, 2-(Butoxy)-
 butoxy, 2-(1-Methylpropoxy)butoxy, 2-(2-Methylpropoxy)butoxy,
 2-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 3-(Methoxy)butoxy, 3-(Ethoxy)-
 45 butoxy, 3-(Propoxy)butoxy, 3-(1-Methylethoxy)butoxy,
 3-(Butoxy)butoxy, 3-(1-Methylpropoxy)butoxy, 3-(2-Methyl-
 propoxy)butoxy, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 4-(Methoxy)-

11 08.01.98

16

butoxy, 4-(Ethoxy)butoxy, 4-(Propoxy)butoxy, 4-(1-Methylethoxy)butoxy, 4-(Butoxy)butoxy, 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy und 4-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy;

5 - C₂-C₆-Alkandiyl: z.B. Ethan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Butan-1,4-diyl, Pentan-1,5-diyl und Hexan-1,6-diyl;

- C₃-C₈-Cycloalkyl: z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl;

10

Alle Phenylringe sind vorzugsweise unsubstituiert oder tragen ein bis drei Halogenatome und/oder eine Nitrogruppe, einen Cyanoest und/oder einen oder zwei Methyl-, Trifluormethyl-, Methoxy- oder Trifluormethoxysubstituenten.

15

In Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I als Herbizide haben die Variablen vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination:

20

R¹, R² Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

25

besonders bevorzugt Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy,

30

C₁-C₆-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylthio, wie z.B. Methylthio und Ethylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;

35

R³ Wasserstoff;

40 R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 08.01.90

17

Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

5

Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

oder

10 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

15

besonders bevorzugt steht R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder CONR⁷R⁸;

20

besonders bevorzugt steht R⁵ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder
besonders bevorzugt bilden R⁴ und R⁵ eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

25

R⁶ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder NR⁷R⁸;

30 R⁷

Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R⁸

C₁-C₄-Alkyl;

X

O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

35

Y

O, S, NR¹² oder CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹²

Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

40 R¹⁰, R¹¹,

R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl oder CONR⁷R⁸;

oder

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.93

18

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

- R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl;
besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 2-Methylpropyl oder Butyl;
- Z H oder SO₂R¹⁷;
- R¹⁷ C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;
besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl.

Folgende Ausführungsformen der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I sind hervorzuheben:

1. In einer bevorzugten Ausführungsform der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I steht Z für SO₂R¹⁷.
 - Besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.
 - Ebenso besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Methyl steht.

* Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁷ für C₁-C₄-Alkyl steht.

2. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I steht Z für Wasserstoff.

M 000198

19

Besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei X für Sauerstoff und Y für CR¹³R¹⁴ stehen.

5 * Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

10

15

20

R⁴ Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

25

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

30

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

35

R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

40

bedeuten:

45

• Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 08.01.98

20

R⁴ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

5

oder

10

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

15

R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

20

bedeuten.

25

Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

30

* Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei auch 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R⁴ und R⁵ für Wasserstoff stehen.

35

• Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

40

Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

45

R¹ Nitro, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl und Ethylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 08.01.98

21

z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluor-
ethylsulfonyl;

bedeutet.

5

Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt sind
hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoyl-
derivate der Formel I, wobei

10

R² Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom,
C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl
und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylthio wie z.B.
Methylthio und Ethylthio, C₁-C₆-Alkyl-
sulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethyl-
sulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B.
Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propyl-
sulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,
wie z.B. Trifluormethylsulfonyl und Penta-
fluorethylsulfonyl;

15

20

bedeuten.

25

Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt ist
4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-
methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-
pyrazol.

30

- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind hierbei
3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der
Formel I, wobei R¹⁸ für Methyl steht.

35

Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei
3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der
Formel I, wobei

40

R¹ Nitro, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und
Ethyl, C₁-C₆-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und
Ethoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl wie z.B. Difluor-
methyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkyl-
sulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl und Ethyl-
sulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,
z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluor-
ethylsulfonyl;

45

bedeutet.

11 05.01.98

22

Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

5

R² Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl,

10

C₁-C₆-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylthio wie z.B. Methylthio und Ethylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluomethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;

15

bedeutet.

20

Ebenso besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

X für S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

oder

25

Y für O, S, NR¹² oder CO;

stehen.

30

* Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

35

* Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für C₁-C₆-Alkyl bedeutet.

40

• Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

45

R⁴ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoylalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy,

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 08.01.98

23

C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

10

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

15

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

20

oder

25

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl-substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

30

bedeuten.

35

* Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

X für S, NR⁹ oder CO

oder

40

y für O, NR¹² oder CO

45

• Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

H 08.01.98

24

5

R⁴ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoylalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy,

10

C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

15

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

20

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

25

oder

30

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl-substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

35

bedeuten.

40

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

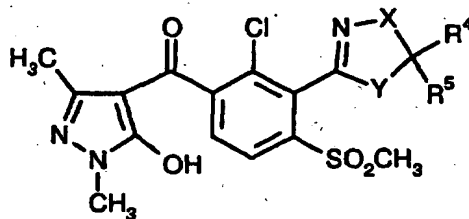
M 08.01.90

25

Insbesondere außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen Ia1 (\cong I mit $R^1 = Cl$, $R^2 = SO_2CH_3$, $R^3 = H$, R^{16} , $R^{18} = CH_3$, $Z=H$), insbesondere die Verbindungen der Tabelle 1.

5

10



Ia1

Tabelle 1

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|--------|--|-------------------------------|-----------------------------------|----|
| Ia1.1 | CH ₂ | H | CH ₃ | O |
| Ia1.2 | CH ₂ | H | H | O |
| Ia1.3 | C(CH ₃) ₂ | H | H | O |
| Ia1.4 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.5 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | O |
| Ia1.6 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | O |
| Ia1.7 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | O |
| Ia1.8 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | O |
| Ia1.9 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | O |
| Ia1.10 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.11 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | O |
| Ia1.12 | C=O | CH ₃ | CH ₃ | O |
| Ia1.13 | C=O | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.14 | C=O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.15 | C=O | H | H | O |
| Ia1.16 | C=O | H | CH ₃ | O |
| Ia1.17 | CH ₂ | H | CH ₃ | S |
| Ia1.18 | C(CH ₃) ₂ | H | H | S |
| Ia1.19 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | S |
| Ia1.20 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | S |
| Ia1.21 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | S |
| Ia1.22 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | S |
| Ia1.23 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | S |
| Ia1.24 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | S |
| Ia1.25 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | S |
| Ia1.26 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | S |
| Ia1.27 | CH ₂ | H | CH ₃ | NH |
| Ia1.28 | CH ₂ | H | H | NH |
| Ia1.29 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NH |
| Ia1.30 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NH |
| Ia1.31 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| Ia1.32 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NH |

45

H 08.01.98

26

| | Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|--------|---|-----------------|-----------------------------------|--------------------------------|
| 5 | Ia1.33 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NH |
| | Ia1.34 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NH |
| | Ia1.35 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NH |
| | Ia1.36 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NH |
| | Ia1.37 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NH |
| 10 | Ia1.38 | CH ₂ | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ia1.39 | CH ₂ | H | H | NCH ₃ |
| | Ia1.40 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NCH ₃ |
| | Ia1.41 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | Ia1.42 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ia1.43 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ia1.44 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| 15 | Ia1.45 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NCH ₃ |
| | Ia1.46 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NCH ₃ |
| | Ia1.47 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | Ia1.48 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NCH ₃ |
| 20 | Ia1.49 | CH ₂ | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.50 | CH ₂ | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.51 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.52 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.53 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.54 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.55 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| 25 | Ia1.56 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.57 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.58 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NC ₂ H ₅ |
| | Ia1.59 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NC ₂ H ₅ |
| 30 | Ia1.60 | CH ₂ | | =O | S |
| | Ia1.61 | CH(CH ₃) | | =O | S |
| | Ia1.62 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | S |
| | Ia1.63 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | S |
| | Ia1.64 | C(CH ₃) ₂ | | =O | S |
| | Ia1.65 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | S |
| | Ia1.66 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | S |
| 35 | Ia1.67 | CH ₂ | | =O | NH |
| | Ia1.68 | CH(CH ₃) | | =O | NH |
| | Ia1.69 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | NH |
| | Ia1.70 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | NH |
| | Ia1.71 | C(CH ₃) ₂ | | =O | NH |
| | Ia1.72 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | NH |
| | Ia1.73 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | NH |
| 40 | Ia1.74 | CH ₂ | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.75 | CH(CH ₃) | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.76 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.77 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.78 | C(CH ₃) ₂ | | =O | NCH ₃ |
| 45 | | | | | |
| | | | | | |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

27

| | Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|---------|--|--|-------------------------------|-------------------------|
| | Ia1.79 | $\text{CCH}_3(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| | Ia1.80 | $\text{CCH}_3[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 5 | Ia1.81 | O | COOCH_3 | H | CH_2 |
| | Ia1.82 | O | COOC_2H_5 | H | CH_2 |
| | Ia1.83 | O | CONHCH_3 | H | CH_2 |
| | Ia1.84 | O | $\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ | H | CH_2 |
| | Ia1.85 | O | CONHC_2H_5 | H | CH_2 |
| 10 | Ia1.86 | O | $\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ | H | CH_2 |
| | Ia1.87 | O | CH_3 | H | CH_2 |
| | Ia1.88 | O | C_2H_5 | H | CH_2 |
| | Ia1.89 | O | $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ | H | CH_2 |
| | Ia1.90 | O | COC_2H_5 | H | CH_2 |
| 15 | Ia1.91 | O | CH_2CN | H | CH_2 |
| | Ia1.92 | O | $\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ | H | CH_2 |
| | Ia1.93 | O | $\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | H | CH_2 |
| | Ia1.94 | O | $\text{CH}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ | H | CH_2 |
| | Ia1.95 | O | $\text{CH}(\text{OCH}_3)_2$ | H | CH_2 |
| 20 | Ia1.96 | O | CH_3 | CH_3 | CH_2 |
| | Ia1.97 | O | CH_3 | C_2H_5 | CH_2 |
| | Ia1.98 | O | C_2H_5 | C_2H_5 | CH_2 |
| | Ia1.99 | O | $-(\text{CH}_2)_4-$ | | CH_2 |
| | Ia1.100 | O | $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$ | | CH_2 |
| 25 | Ia1.101 | O | H | $-(\text{CH}_2)_3-\text{CH}-$ | |
| | Ia1.102 | O | H | $-(\text{CH}_2)_4-\text{CH}-$ | |
| | Ia1.103 | O | CH_3 | H | CHCH_3 |
| | Ia1.104 | S | | $=\text{O}$ | O |
| | Ia1.105 | CH_2 | | $=\text{S}$ | S |
| 30 | Ia1.106 | $\text{CH}(\text{CH}_3)$ | | $=\text{S}$ | S |
| | Ia1.107 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{S}$ | S |
| | Ia1.108 | $\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | | $=\text{S}$ | S |
| | Ia1.109 | O | | $=\text{O}$ | NH |
| | Ia1.110 | O | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 35 | Ia1.111 | O | CH_3 | H | NH |
| | Ia1.112 | O | C_2H_5 | H | NH |
| | Ia1.113 | O | CH_3 | CH_3 | NH |
| | Ia1.114 | O | C_2H_5 | C_2H_5 | NH |
| | Ia1.115 | O | CH_3 | H | NCH_3 |
| | Ia1.116 | O | C_2H_5 | H | NCH_3 |
| 40 | Ia1.117 | O | CH_3 | CH_3 | NCH_3 |
| | Ia1.118 | O | C_2H_5 | C_2H_5 | NCH_3 |
| | Ia1.119 | NH | | $=\text{O}$ | NH |
| | Ia1.120 | NH | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| | Ia1.121 | NCH_3 | | $=\text{O}$ | NH |
| 45 | Ia1.122 | NCH_3 | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| | Ia1.123 | NC_2H_5 | | $=\text{O}$ | NH |
| | Ia1.124 | NC_2H_5 | | $=\text{O}$ | NC_2H_5 |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

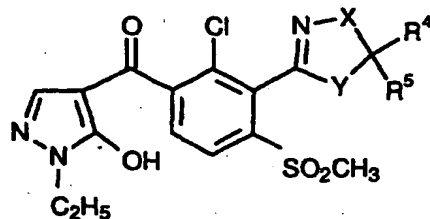
M 08.01.98

28

Desweiteren sind folgende Benzoylderivate der Formel I insbesondere außerordentlich bevorzugt:

- 5 die Verbindungen Ia2.1-Ia2.124, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia1.1-Ia1.124 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

10

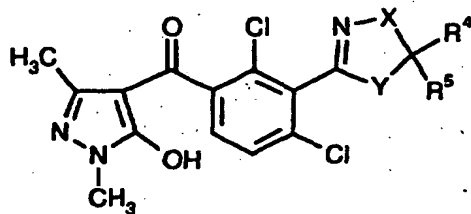


Ia2

15

Ebenso insbesondere außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen Ib1 (\cong I mit R¹, R² = Cl, R³ = H, R¹⁶, R¹⁸ = CH₃, Z = H) insbesondere die Verbindungen der Tabelle 2

20



Ib1

25

Tabelle 2

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|--------|--|-------------------------------|-----------------------------------|---|
| Ib1.1 | CH ₂ | H | CH ₃ | O |
| Ib1.2 | CH ₂ | H | H | O |
| Ib1.3 | C(CH ₃) ₂ | H | H | O |
| Ib1.4 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ib1.5 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | O |
| Ib1.6 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | O |
| Ib1.7 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | O |
| Ib1.8 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | O |
| Ib1.9 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | O |
| Ib1.10 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ib1.11 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | O |
| Ib1.12 | C=O | CH ₃ | CH ₃ | O |
| Ib1.13 | C=O | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ib1.14 | C=O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | O |
| Ib1.15 | C=O | H | H | O |
| Ib1.16 | C=O | H | CH ₃ | O |
| Ib1.17 | CH ₂ | H | CH ₃ | S |

M 08.01.98

| | Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|--------|--|-----------------|-----------------------------------|--------------------------------|
| | 1b1.18 | CH ₂ | H | H | S |
| | 1b1.19 | C(CH ₃) ₂ | H | H | S |
| 5 | 1b1.20 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | S |
| | 1b1.21 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | S |
| | 1b1.22 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | S |
| | 1b1.23 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | S |
| | 1b1.24 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | S |
| 10 | 1b1.25 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | S |
| | 1b1.26 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | S |
| | 1b1.27 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | S |
| | 1b1.28 | CH ₂ | H | CH ₃ | NH |
| | 1b1.29 | CH ₂ | H | H | NH |
| 15 | 1b1.30 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NH |
| | 1b1.31 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NH |
| | 1b1.32 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| | 1b1.33 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NH |
| | 1b1.34 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NH |
| | 1b1.35 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NH |
| 20 | 1b1.36 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NH |
| | 1b1.37 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NH |
| | 1b1.38 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NH |
| | 1b1.39 | CH ₂ | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| 25 | 1b1.40 | CH ₂ | H | H | NCH ₃ |
| | 1b1.41 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NCH ₃ |
| | 1b1.42 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | 1b1.43 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NCH ₃ |
| | 1b1.44 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| | 1b1.45 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| 30 | 1b1.46 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NCH ₃ |
| | 1b1.47 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NCH ₃ |
| | 1b1.48 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | 1b1.49 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NCH ₃ |
| | 1b1.50 | CH ₂ | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| 35 | 1b1.51 | CH ₂ | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.52 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.53 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.54 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.55 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| 40 | 1b1.56 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.57 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.58 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.59 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NC ₂ H ₅ |
| | 1b1.60 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NC ₂ H ₅ |
| 45 | 1b1.61 | CH ₂ | | =O | S |
| | 1b1.62 | CH(CH ₃) | | =O | S |
| | 1b1.63 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | S |

M 050198

30

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|------------|---|---|---------------------------------------|-------------------|
| 1b1.64 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | S |
| 1b1.65 | C(CH ₃) ₂ | | =O | S |
| 5 1b1.66 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | S |
| 1b1.67 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | S |
| 1b1.68 | CH ₂ | | =O | NH |
| 1b1.69 | CH(CH ₃) | | =O | NH |
| 1b1.70 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | NH |
| 10 1b1.71 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | NH |
| 1b1.72 | C(CH ₃) ₂ | | =O | NH |
| 1b1.73 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | NH |
| 1b1.74 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | NH |
| 1b1.75 | CH ₂ | | =O | NCH ₃ |
| 15 1b1.76 | CH(CH ₃) | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.77 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.78 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.79 | C(CH ₃) ₂ | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.80 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | NCH ₃ |
| 20 1b1.81 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.82 | O | COOCH ₃ | H | CH ₂ |
| 1b1.83 | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 1b1.84 | O | CONHCH ₃ | H | CH ₂ |
| 1b1.85 | O | CON(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 1b1.86 | O | CONHC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 25 1b1.87 | O | CON(C ₂ H ₅) ₂ | H | CH ₂ |
| 1b1.88 | O | CH ₃ | H | CH ₂ |
| 1b1.89 | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 1b1.90 | O | CH(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 1b1.91 | O | COC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 30 1b1.92 | O | CH ₂ CN | H | CH ₂ |
| 1b1.93 | O | CH ₂ N(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 1b1.94 | O | CH ₂ ON=C(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 1b1.95 | O | CH(OC ₂ H ₅) ₂ | H | CH ₂ |
| 1b1.96 | O | CH(OCH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 35 1b1.97 | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ |
| 1b1.98 | O | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₂ |
| 1b1.99 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ |
| 1b1.100 | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ |
| 1b1.101 | O | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ |
| 40 1b1.102 | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | |
| 1b1.103 | O | H | -(CH ₂) ₄ -CH- | |
| 1b1.104 | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ |
| 1b1.105 | O | H | H | CH ₂ |
| 1b1.106 | S | | =O | O |
| 45 1b1.107 | CH ₂ | | =S | S |
| 1b1.108 | CH(CH ₃) | | =S | S |
| 1b1.109 | CH(C ₂ H ₅) | | =S | S |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 08.01.98

31

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|------------|----------------------------------|-------------------------------|-------------------------------|--------------------------------|
| 1b1.110 | C(CH ₃) ₂ | | =S | S |
| 1b1.111 | O | | =O | NH |
| 5 1b1.112 | O | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.113 | O | CH ₃ | H | NH |
| 1b1.114 | O | C ₂ H ₅ | H | NH |
| 1b1.115 | O | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| 1b1.116 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | NH |
| 10 1b1.117 | O | CH ₃ | H | NCH ₃ |
| 1b1.118 | O | C ₂ H ₅ | H | NCH ₃ |
| 1b1.119 | O | CH ₃ | CH ₃ | NCH ₃ |
| 1b1.120 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| 1b1.121 | NH | | =O | NH |
| 15 1b1.122 | NH | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.123 | NCH ₃ | | =O | NH |
| 1b1.124 | NCH ₃ | | =O | NCH ₃ |
| 1b1.125 | NC ₂ H ₅ | | =O | NH |
| 1b1.126 | NC ₂ H ₅ | | =O | NC ₂ H ₅ |

20

Desweiteren sind folgende 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoyl-
derivate der Formel I insbesondere außerordentlich bevorzugt:

25

30

35

40

45

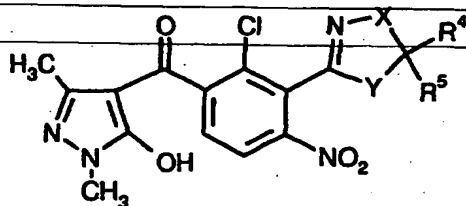
M 08.01.98

32

- die Verbindungen Ib2.1-Ib2.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro steht.

5

10

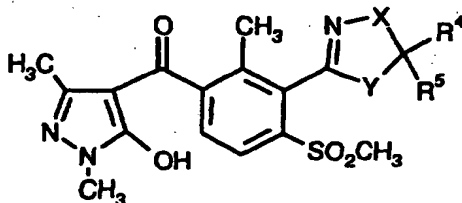


Ib2

- die Verbindungen Ib3.1-Ib3.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl und R² für Methylsulfonyl stehen.

15

20

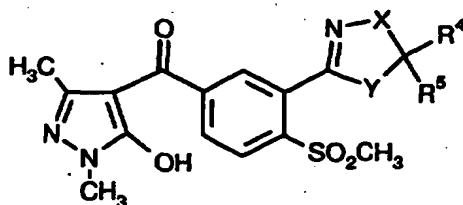


Ib3

- die Verbindungen Ib4.1-Ib4.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Wasserstoff und R² für Methylsulfonyl stehen.

25

30

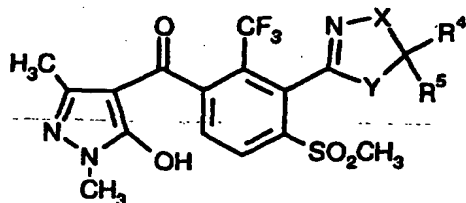


Ib4

- die Verbindungen Ib5.1-Ib5.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Trifluormethyl und R² für Methylsulfonyl stehen.

35

40



Ib5

- die Verbindungen Ib6.1-Ib6.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl steht.

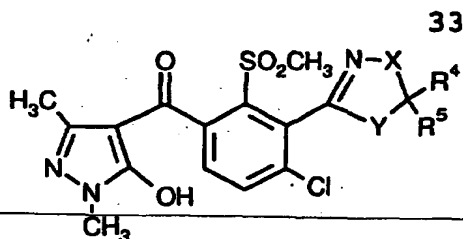
45

BASF Aktiengesellschaft

960970

M 08.01.98

5

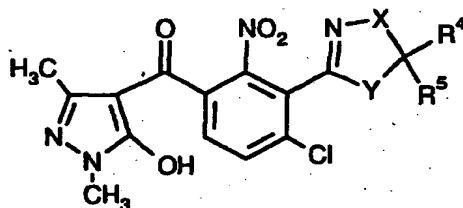


Ib6

10

- die Verbindungen Ib7.1-Ib7.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro steht.

15

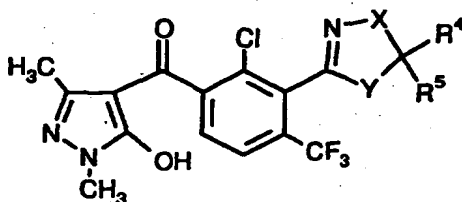


Ib7

20

- die Verbindungen Ib8.1-Ib8.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethyl steht.

25

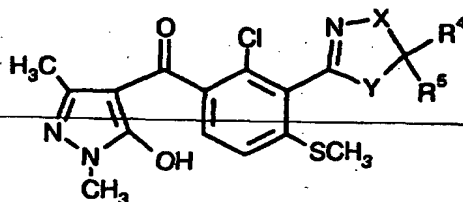


Ib8

30

- die Verbindungen Ib9.1-Ib9.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylthio steht.

35



Ib9

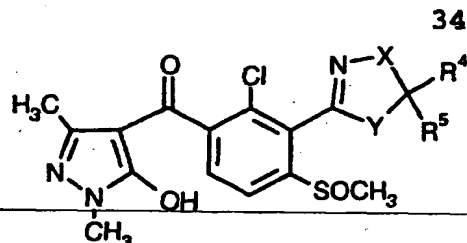
40

- die Verbindungen Ib10.1-Ib10.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfinyl steht.

45

N 08.01.98

5

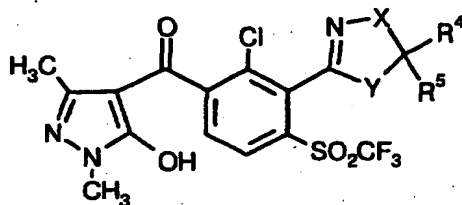


Ib10

10

- die Verbindungen Ib11.1-Ib11.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethylsulfonyl steht.

15

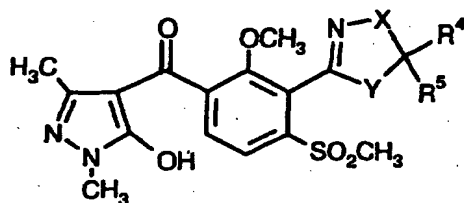


Ib11

20

- die Verbindungen Ib12.1-Ib12.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy und R² für Methylsulfonyl stehen.

25

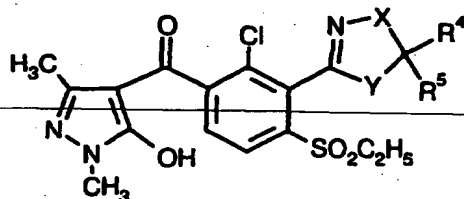


Ib12

30

- die Verbindungen Ib13.1-Ib13.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl steht.

35



Ib13

40

- die Verbindungen Ib14.1-Ib14.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl und R³ für Methyl stehen.

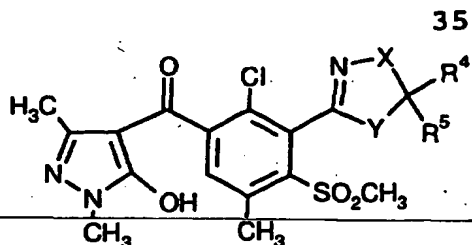
45

BASF Aktiengesellschaft

960970

N 08.01.93

5

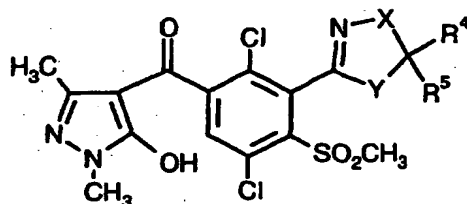


Ib14

10

- die Verbindungen Ib15.1-Ib15.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl und R³ für Chlor stehen.

15

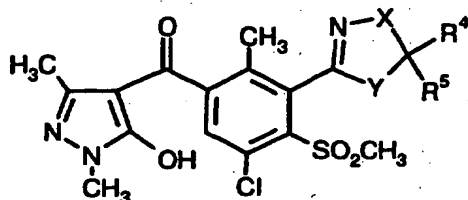


Ib15

20

- die Verbindungen Ib16.1-Ib16.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl und R³ für Chlor stehen.

25

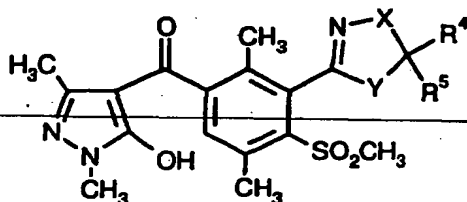


Ib16

30

- die Verbindungen Ib17.1-Ib17.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl und R³ für Methyl stehen.

35



Ib17

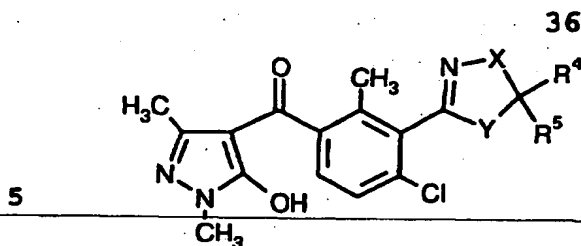
40

- die Verbindungen Ib18.1-Ib18.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl steht.

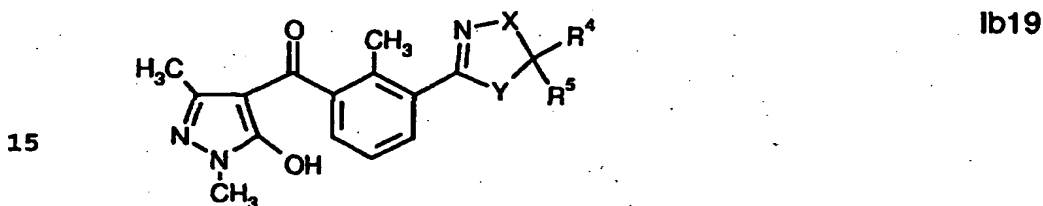
45

N 08.01.98

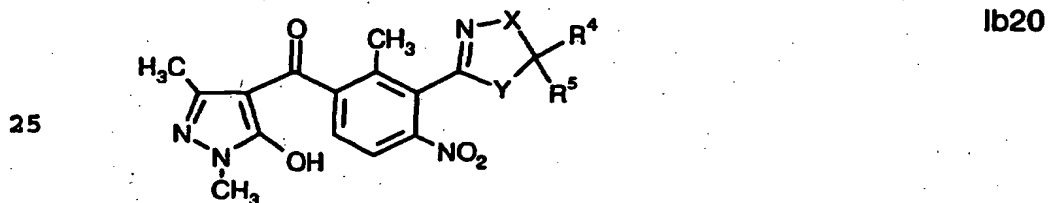
Ib18



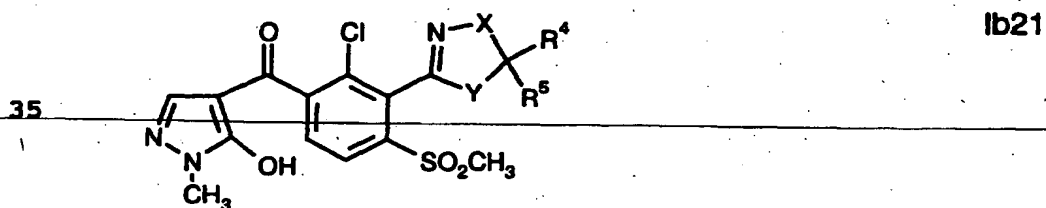
- 10 - die Verbindungen Ib19.1-Ib19.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl und R² für Wasserstoff stehen.



- 20 - die Verbindungen Ib20.1-Ib20.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl und R² für Nitro stehen.



- 30 - die Verbindungen Ib21.1-Ib21.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 40 - die Verbindungen Ib22.1-Ib22.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

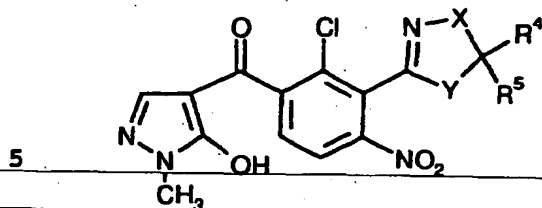
BASF Aktiengesellschaft

960970

N 08.01.98

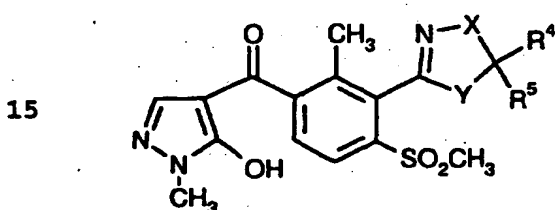
37

Ib22



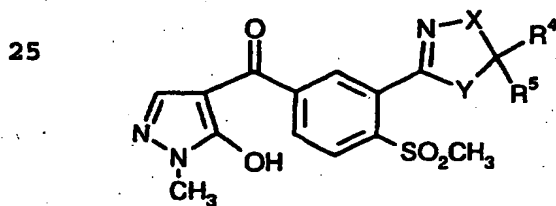
- 10 - die Verbindungen Ib23.1-Ib23.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib23



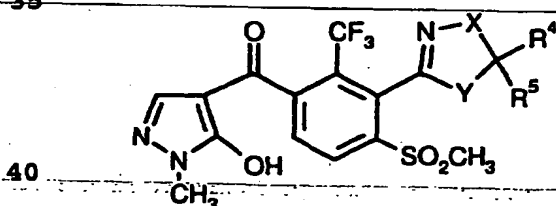
- 20 - die Verbindungen Ib24.1-Ib24.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Wasserstoff, R² für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib24



- 30 - die Verbindungen Ib25.1-Ib25.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Trifluormethyl, R² für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib25



- 45 - die Verbindungen Ib26.1-Ib26.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

BASF Aktiengesellschaft

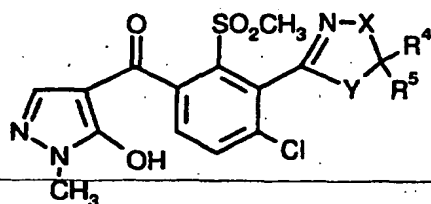
960970

M 08.01.98

38

Ib26

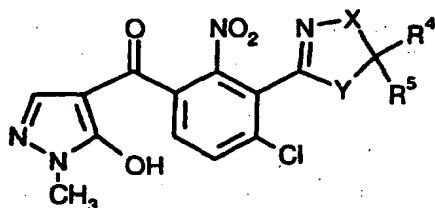
5



10

- die Verbindungen Ib27.1-Ib27.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

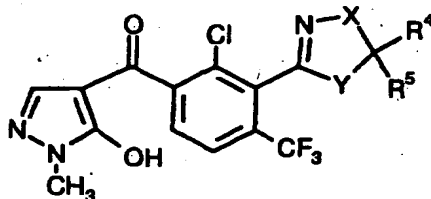


Ib27

20

- die Verbindungen Ib28.1-Ib28.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

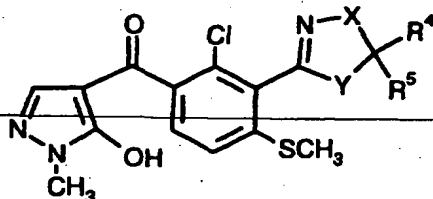


Ib28

30

- die Verbindungen Ib29.1-Ib29.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylthio und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib29

40

- die Verbindungen Ib30.1-Ib30.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45

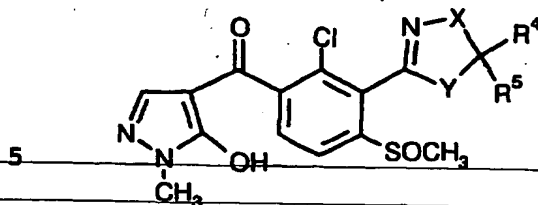
BASF Aktiengesellschaft

960970

N 08.01.98

39

Ib30

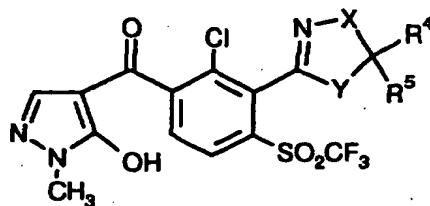


10

- die Verbindungen Ib31.1-Ib31.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib31

15

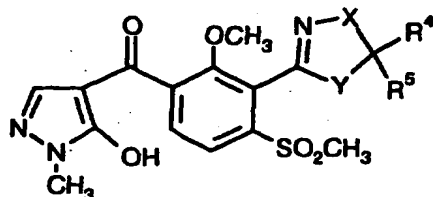


20

- die Verbindungen Ib32.1-Ib32.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib32

25

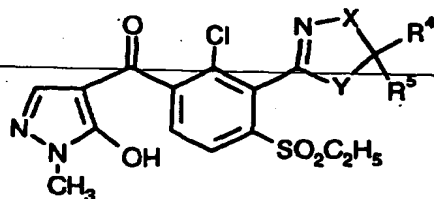


30

- die Verbindungen Ib33.1-Ib33.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib33

35



40

- die Verbindungen Ib34.1-Ib34.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

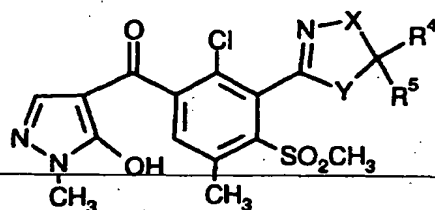
45

N 08.01.98

40

Ib34

5

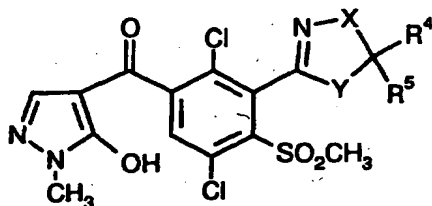


10

- die Verbindungen Ib35.1-Ib35.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib35

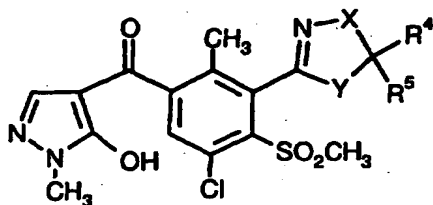


20

- die Verbindungen Ib36.1-Ib36.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib36

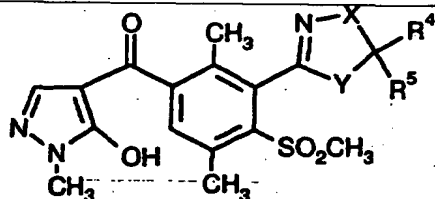


30

- die Verbindungen Ib37.1-Ib37.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

Ib37



40

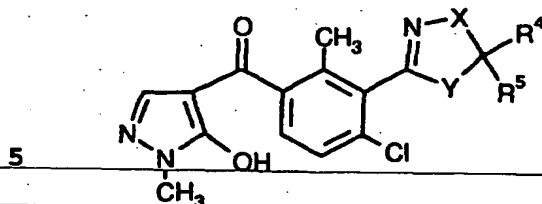
- die Verbindungen Ib38.1-Ib38.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45

N 08.01.98

41

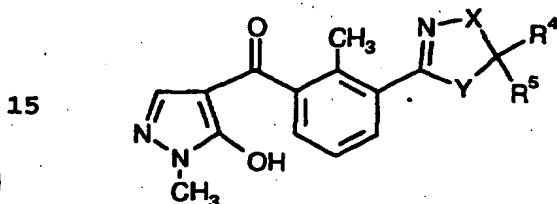
Ib38



10

- die Verbindungen Ib39.1-Ib39.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Wasserstoff und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

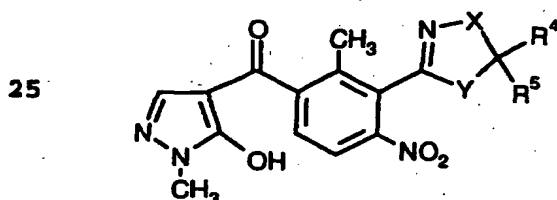
Ib39



20

- die Verbindungen Ib40.1-Ib40.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Nitro und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

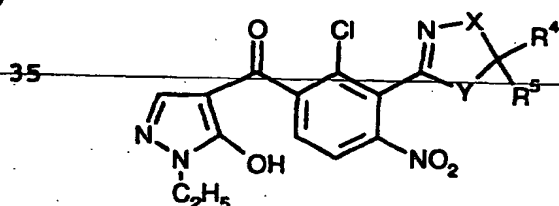
Ib40



30

- die Verbindungen Ib41.1-Ib41.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib41



40

- die Verbindungen Ib42.1-Ib42.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

45

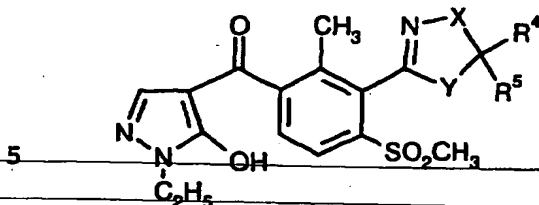
BASF Aktiengesellschaft

960970

M 08.01.98

42

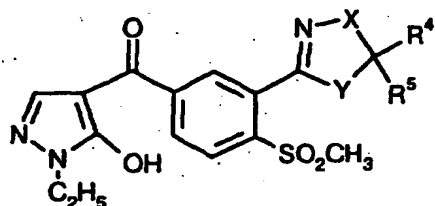
Ib42



10

- die Verbindungen Ib43.1-Ib43.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

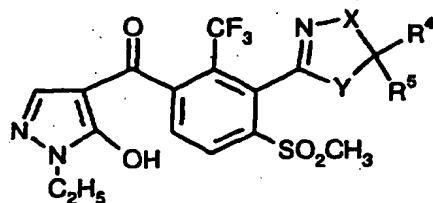


Ib43

20

- die Verbindungen Ib44.1-Ib44.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

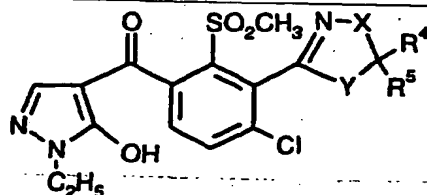


Ib44

30

- die Verbindungen Ib45.1-Ib45.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib45

40

- die Verbindungen Ib46.1-Ib46.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45

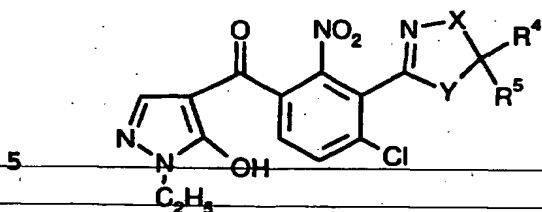
BASF Aktiengesellschaft

960970

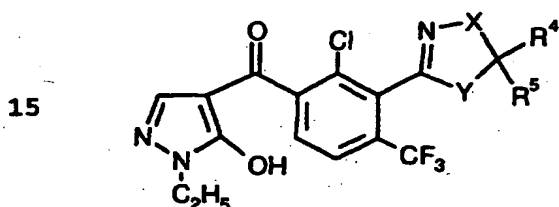
H 08.01.98

43

Ib46

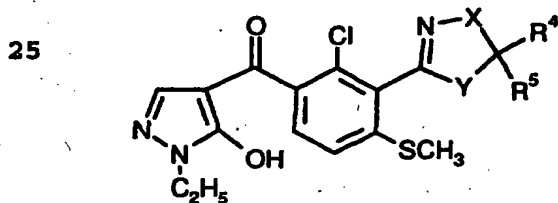


- 10 - die Verbindungen Ib47.1-Ib47.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



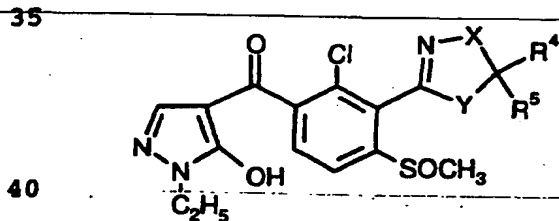
Ib47

- 20 - die Verbindungen Ib48.1-Ib48.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylthio, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib48

- 30 - die Verbindungen Ib49.1-Ib49.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfinyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

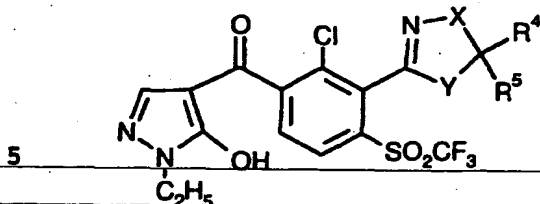


Ib49

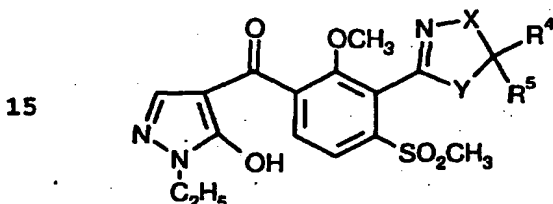
- 40 - die Verbindungen Ib50.1-Ib50.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.
- 45

N 08.01.98

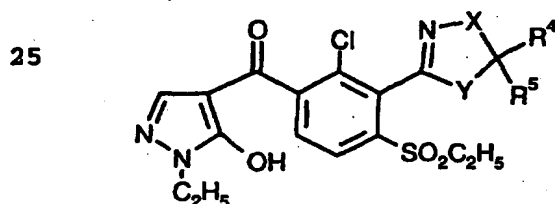
44



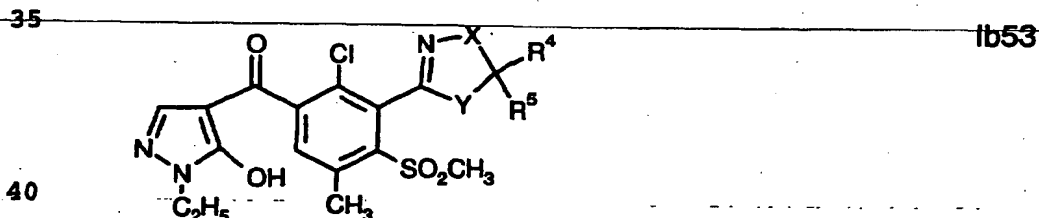
- 10 - die Verbindungen Ib51.1-Ib51.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 20 - die Verbindungen Ib52.1-Ib52.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 30 - die Verbindungen Ib53.1-Ib53.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

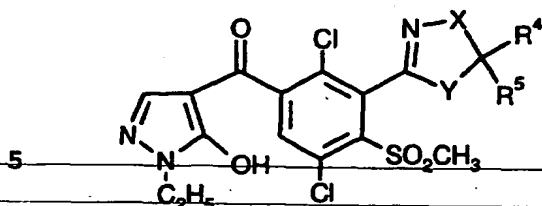


- 45 - die Verbindungen Ib54.1-Ib54.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

N 08.01.93

45

Ib54

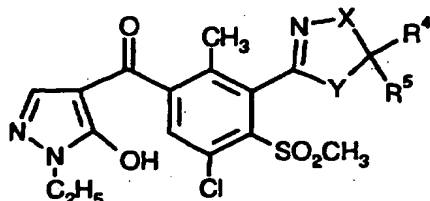


10

die Verbindungen Ib55.1-Ib55.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

Ib55

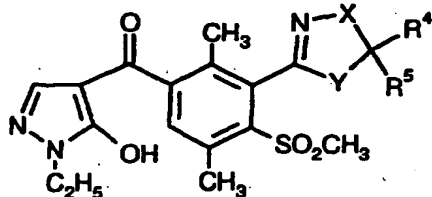


20

die Verbindungen Ib56.1-Ib56.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

Ib56

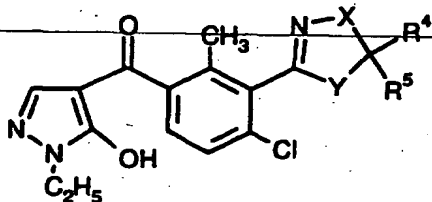


30

die Verbindungen Ib57.1-Ib57.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

Ib57



40

die Verbindungen Ib58.1-Ib58.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Wasserstoff, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

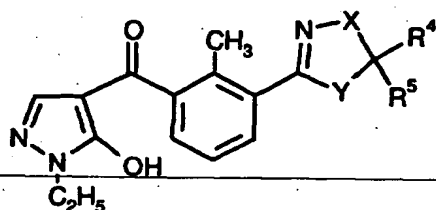
45

M 08.01.98

46

Ib58

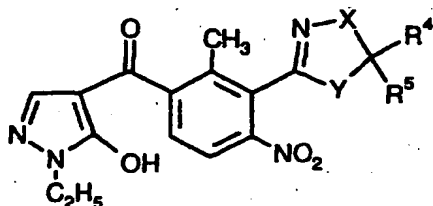
5



10

die Verbindungen Ib59.1-Ib59.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

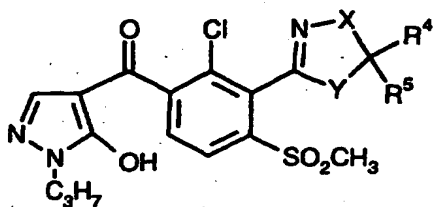


Ib59

20

die Verbindungen Ib61.1-Ib61.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

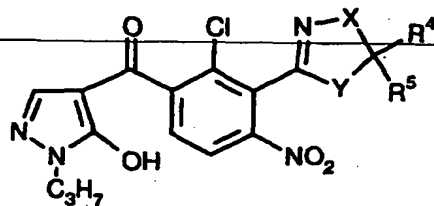


Ib60

30

die Verbindungen Ib61.1-Ib61.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib61

40

die Verbindungen Ib62.1-Ib62.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

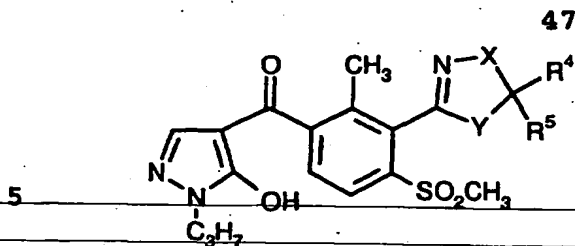
45

BASF Aktiengesellschaft

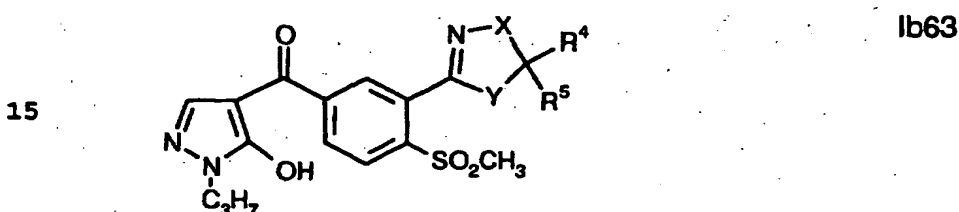
960970

M 08.01.98

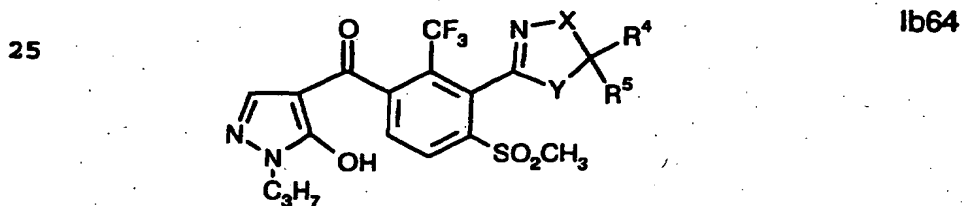
Ib62



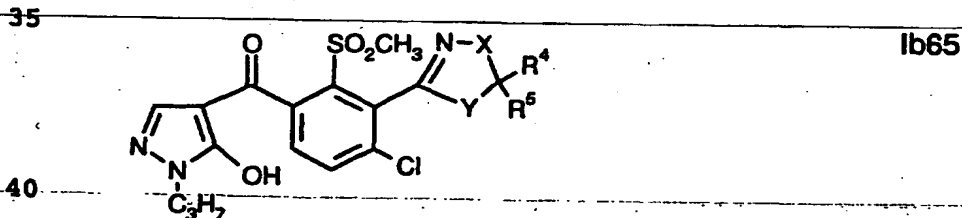
- 10 - die Verbindungen Ib63.1-Ib63.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Wasserstoff, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 20 - die Verbindungen Ib64.1-Ib64.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Trifluormethyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



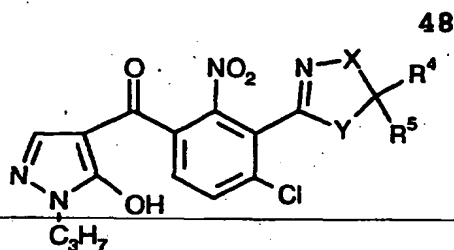
- 30 - die Verbindungen Ib65.1-Ib65.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 40 - die Verbindungen Ib66.1-Ib66.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.
- 45

M 08.01.98

5

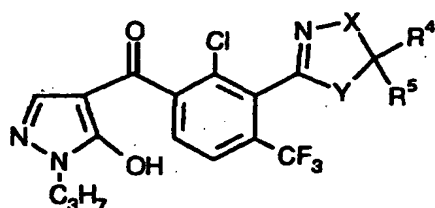


Ib66

10

- die Verbindungen Ib67.1-Ib67.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

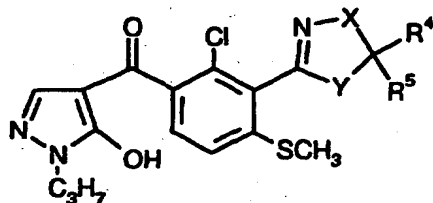


Ib67

20

- die Verbindungen Ib68.1-Ib68.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylthio, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25



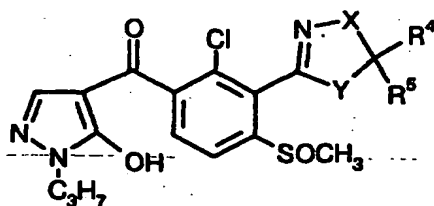
Ib68

30

- die Verbindungen Ib69.1-Ib69.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

40



Ib69

45

- die Verbindungen Ib70.1-Ib70.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

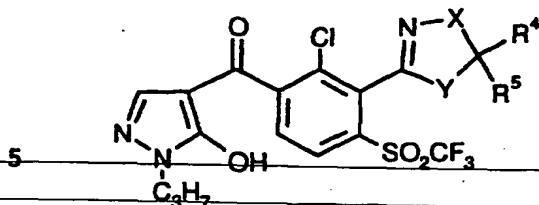
BASF Aktiengesellschaft

960970

M 08.01.98

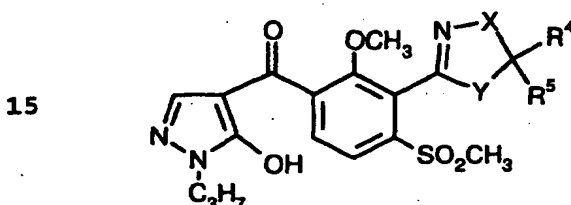
49

Ib70



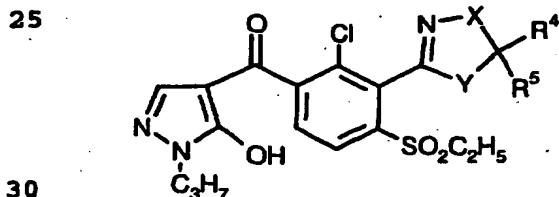
- 10 - die Verbindungen Ib71.1-Ib71.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib71



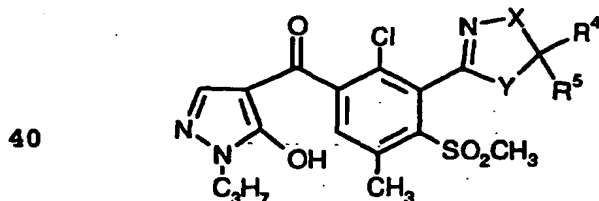
- 20 - die Verbindungen Ib72.1-Ib72.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib72



- 35 - die Verbindungen Ib73.1-Ib73.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib73



- 45 - die Verbindungen Ib74.1-Ib74.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

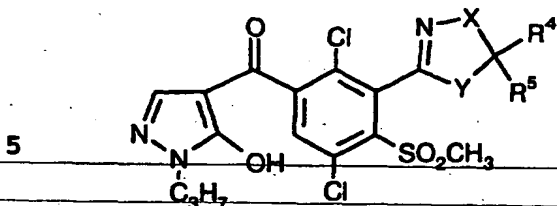
BASF Aktiengesellschaft

960970

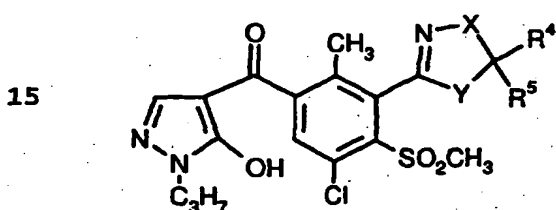
N 08.01.98

50

Ib74

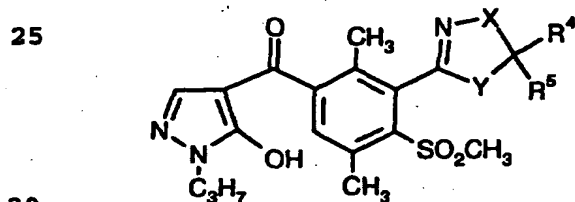


- 10 - die Verbindungen Ib75.1-Ib75.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib75

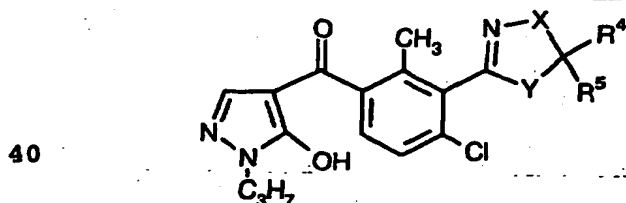
- 20 - die Verbindungen Ib76.1-Ib76.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib76

- 30 - die Verbindungen Ib77.1-Ib77.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35



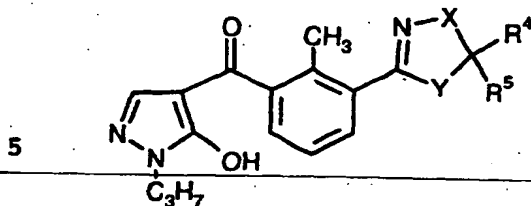
Ib77

- 45 - die Verbindungen Ib78.1-Ib78.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Wasserstoff, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

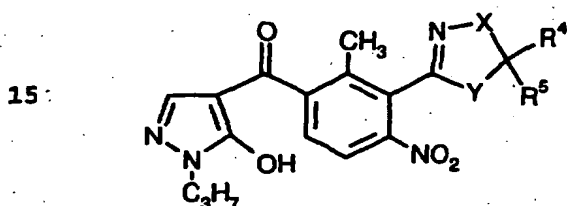
N 08.01.98

51

Ib78

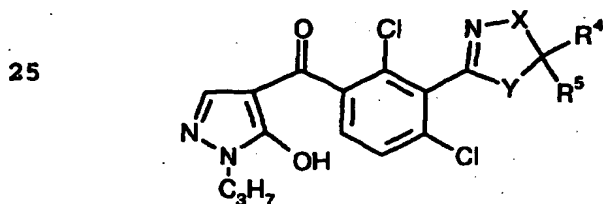


- 10 - die Verbindungen Ib79.1-Ib79.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



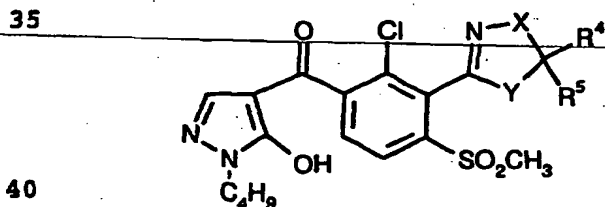
Ib79

- 20 - die Verbindungen Ib80.1-Ib80.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



Ib80

- 30 - die Verbindungen Ib81.1-Ib81.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



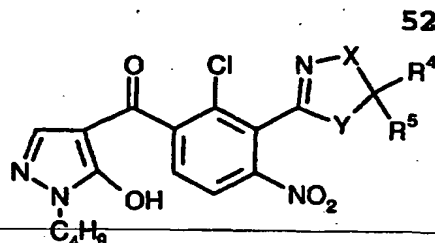
Ib81

- 40 - die Verbindungen Ib82.1-Ib82.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45

N 08.01.98

5

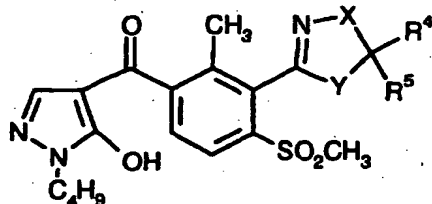


Ib82

10

- die Verbindungen Ib83.1-Ib83.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

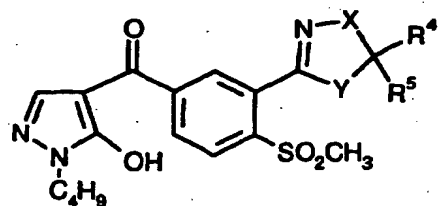


Ib83

20

- die Verbindungen Ib84.1-Ib84.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Wasserstoff, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

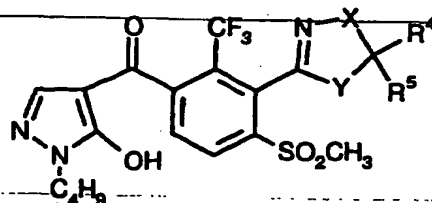


Ib84

30

- die Verbindungen Ib85.1-Ib85.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Trifluormethyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35



Ib85

40

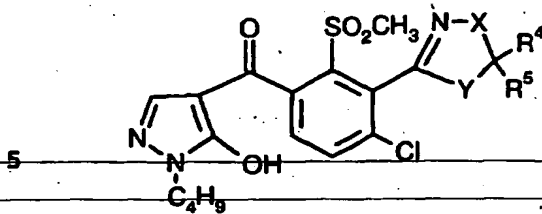
- die Verbindungen Ib86.1-Ib86.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

45

N 08.01.98

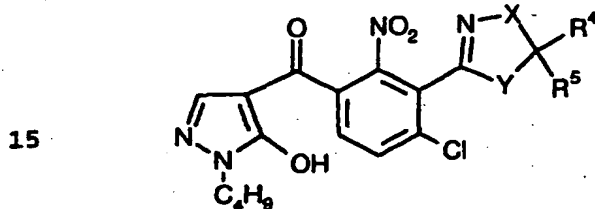
53

Ib86



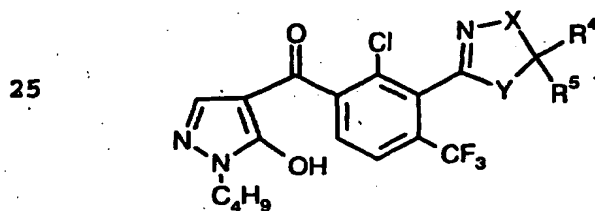
- 10 - die Verbindungen Ib87.1-Ib87.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib87



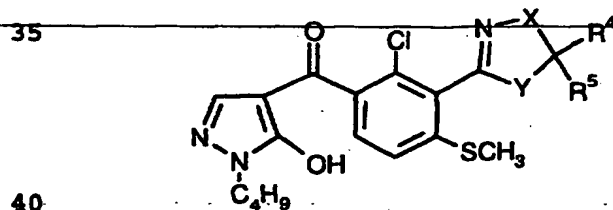
- 20 - die Verbindungen Ib88.1-Ib88.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib88



- 30 - die Verbindungen Ib89.1-Ib89.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylthio, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib89



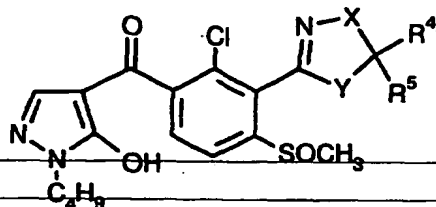
- 45 - die Verbindungen Ib90.1-Ib90.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfinyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

N 08.01.98

54

Ib90

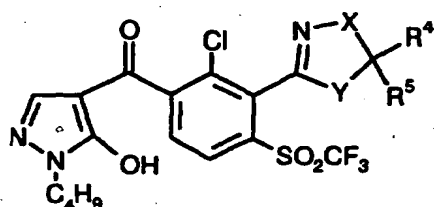
5



10

die Verbindungen Ib91.1-Ib91.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

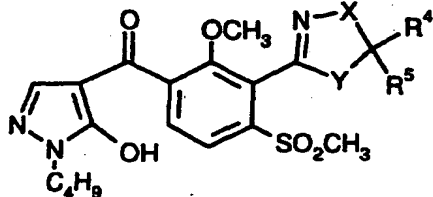


Ib91

20

die Verbindungen Ib92.1-Ib92.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

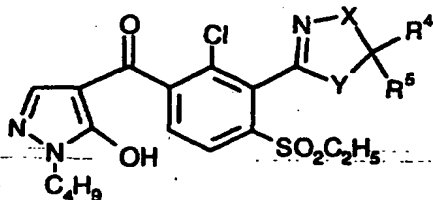


Ib92

30

die Verbindungen Ib93.1-Ib93.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35



Ib93

40

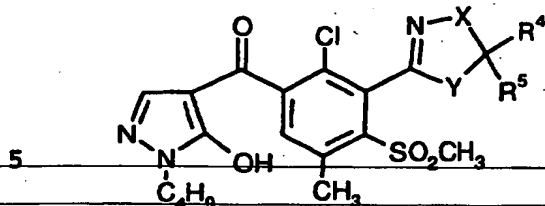
die Verbindungen Ib94.1-Ib94.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

45

N 00.01.98

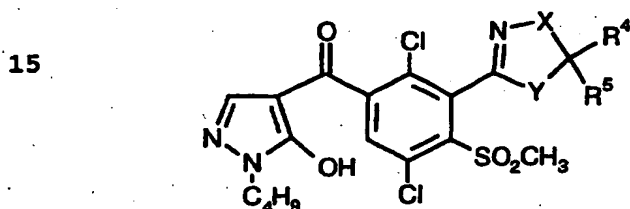
55

Ib94



- 10 - die Verbindungen Ib95.1-Ib95.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

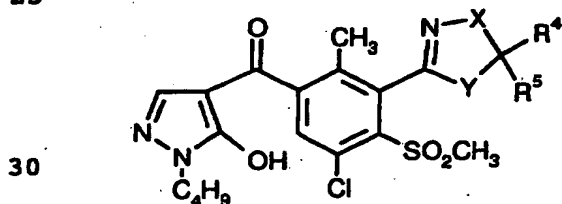
Ib95



- 20 - die Verbindungen Ib96.1-Ib96.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

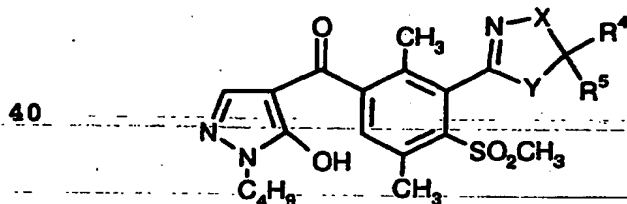
25

Ib96



- 35 - die Verbindungen Ib97.1-Ib97.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib97

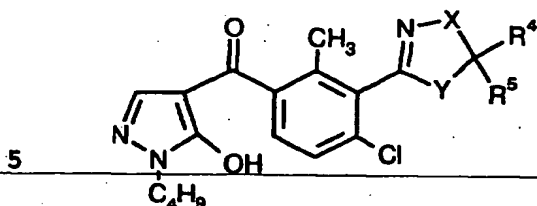


- 45 - die Verbindungen Ib98.1-Ib98.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

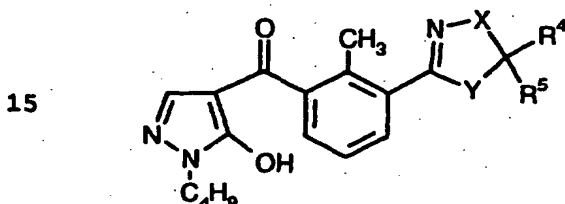
M 08.01.98

56

Ib98

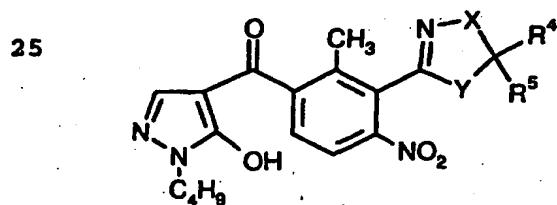


- 10 - die Verbindungen Ib99.1-Ib99.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



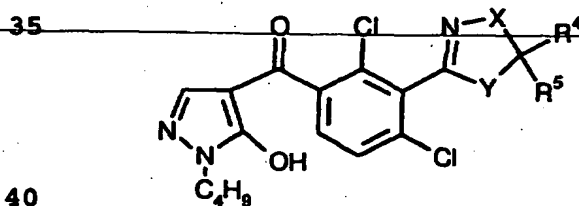
Ib99

- 20 - die Verbindungen Ib100.1-Ib100.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



Ib100

- 30 - die Verbindungen Ib101.1-Ib101.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

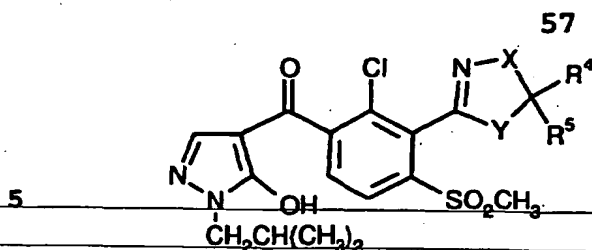


Ib101

- 40 - die Verbindungen Ib102.1-Ib102.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.
- 45

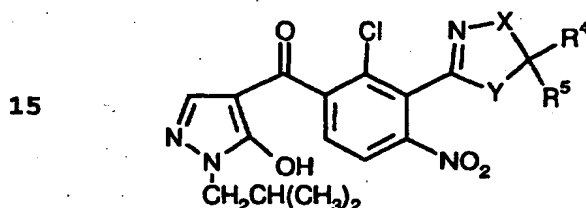
M 08.01.98

Ib102



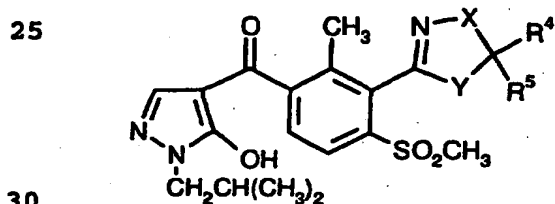
- 10
- die Verbindungen Ib103.1-Ib103.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib103



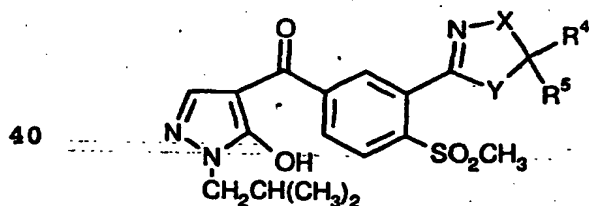
- 20
- die Verbindungen Ib104.1-Ib104.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib104



- 30
- die Verbindungen Ib105.1-Ib105.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

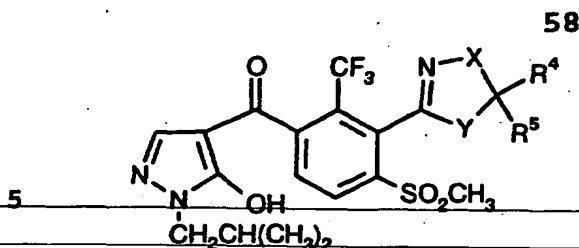
Ib105



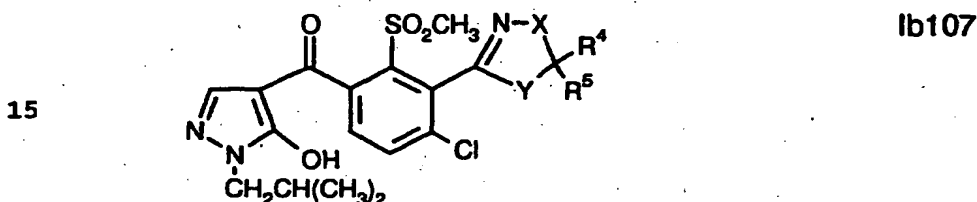
- 40
- die Verbindungen Ib106.1-Ib106.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.
- 45

17 05 01 99

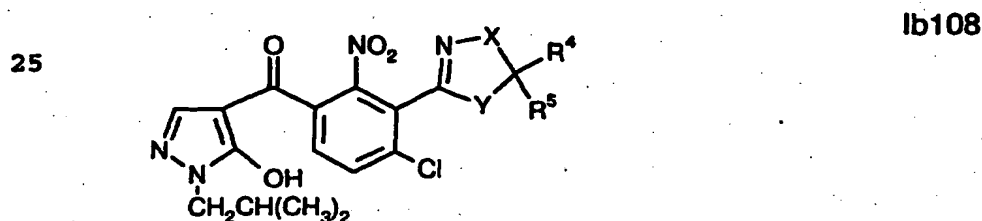
lb106



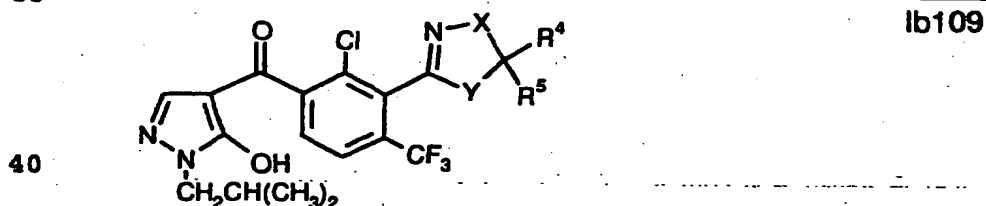
- 10 - die Verbindungen Ib107.1-Ib107.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 20 - die Verbindungen Ib108.1-Ib108.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- die Verbindungen Ib109.1-Ib109.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



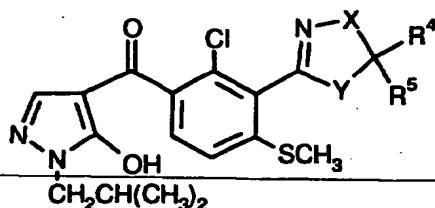
- 45 - die Verbindungen Ib110.1-Ib110.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylthio, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

M 08.01.98

59

Ib110

5

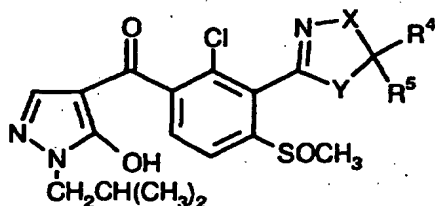


10

die Verbindungen Ib111.1-Ib111.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib111

15

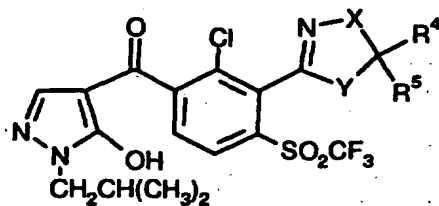


20 -

die Verbindungen Ib112.1-Ib112.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib112

25

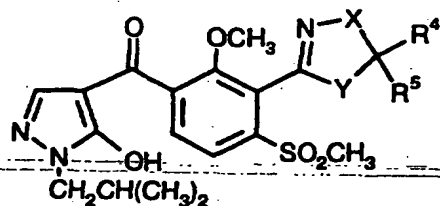


30

die Verbindungen Ib113.1-Ib113.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib113

40



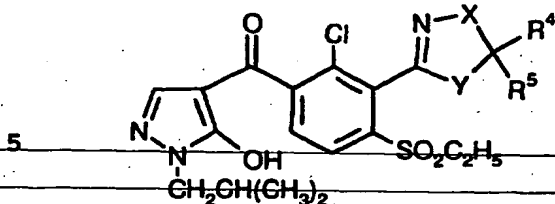
45

die Verbindungen Ib114.1-Ib114.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

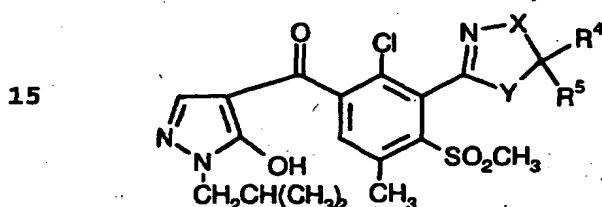
M 08.01.98

60

Ib114

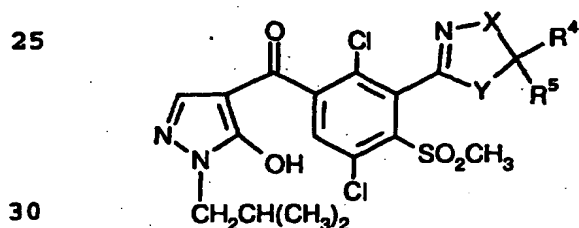


- 10 - die Verbindungen Ib115.1-Ib115.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



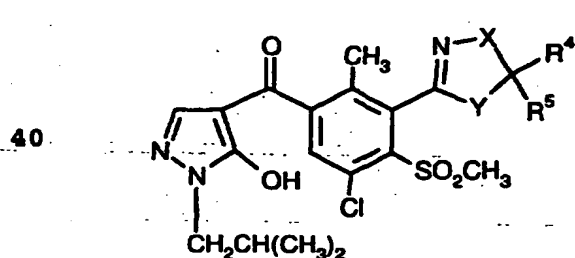
Ib115

- 20 - die Verbindungen Ib116.1-Ib116.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib116

- 35 - die Verbindungen Ib117.1-Ib117.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib117

45

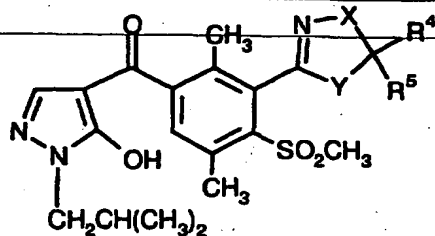
M 08.01.98

61

- die Verbindungen Ib118.1-Ib118.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

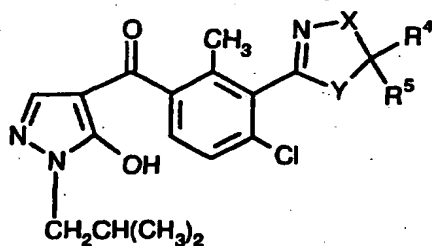


Ib118

15

- die Verbindungen Ib119.1-Ib119.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

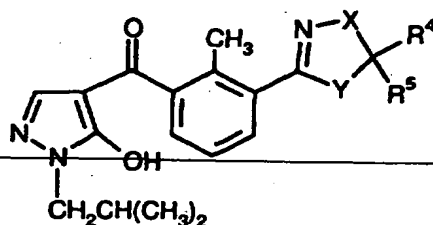


Ib119

25

- die Verbindungen Ib120.1-Ib120.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30



Ib120

35

- die Verbindungen Ib121.1-Ib121.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

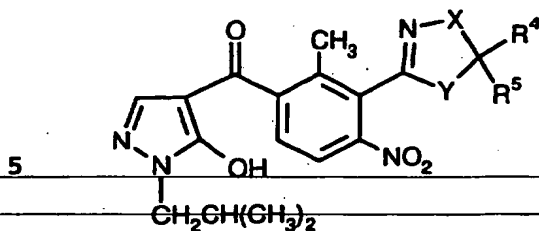
40

45

M 08.01.98

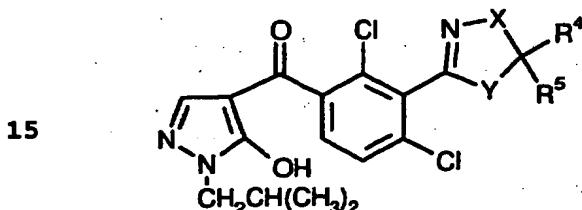
62

Ib121



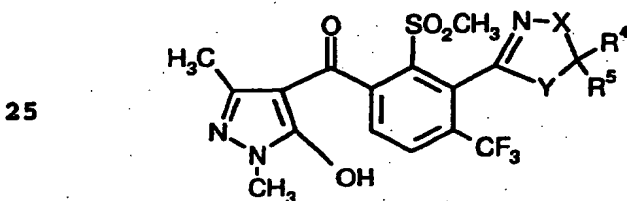
- 10 - die Verbindungen Ib122.1-Ib122.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib122



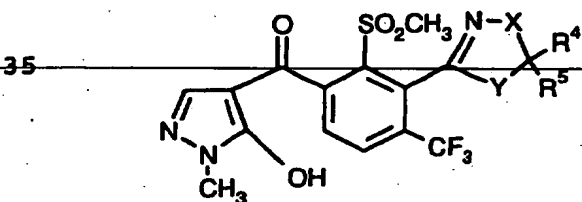
- 20 - die Verbindungen Ib123.1-Ib123.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl und R² für Trifluormethyl stehen.

Ib123



- 30 - die Verbindungen Ib124.1-Ib124.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R² für Trifluormethyl, und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib124



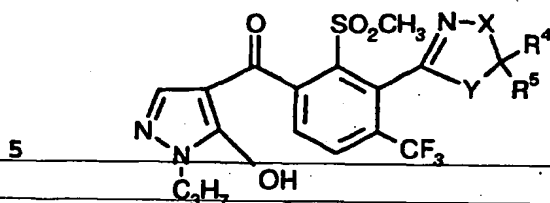
- 40 - die Verbindungen Ib125.1-Ib125.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

45

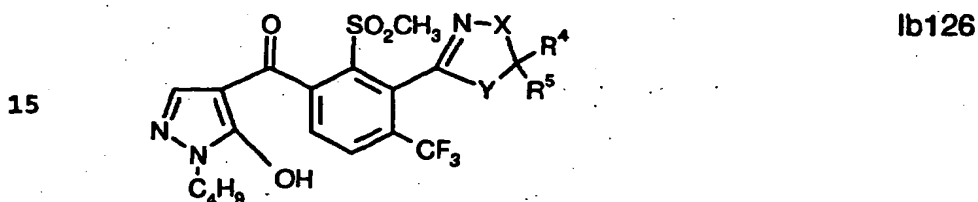
M 08.01.98

63

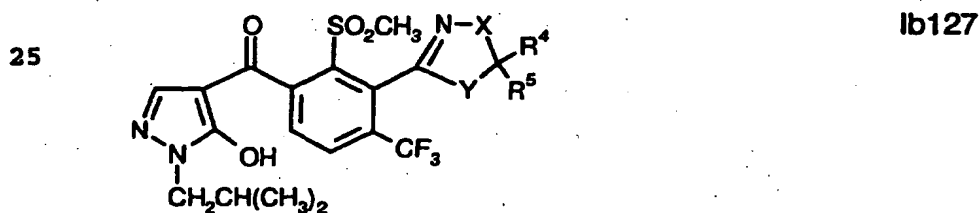
Ib125



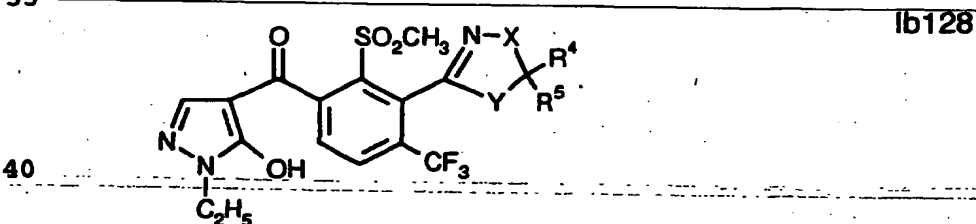
- 10 - die Verbindungen Ib126.1-Ib126.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 20 - die Verbindungen Ib127.1-Ib127.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- 30 - die Verbindungen Ib128.1-Ib128.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R² für Trifluormethyl, R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



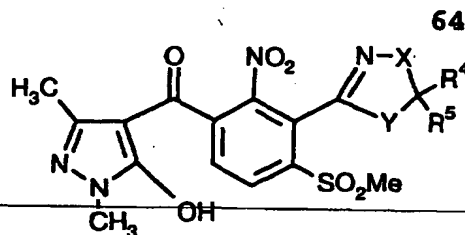
- 40 - die Verbindungen Ib129.1-Ib129.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro und R² für Methylsulfonyl stehen.
- 45

BASF Aktiengesellschaft

960970

M 08.01.98

5

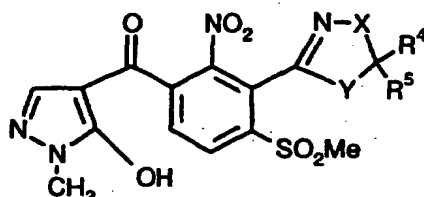


Ib129

10

- die Verbindungen Ib130.1-Ib130.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R² für Methylsulfonyl, und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

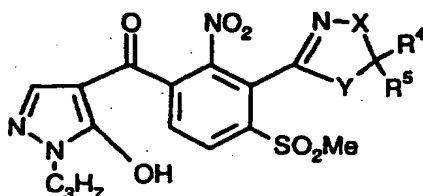


Ib130

20

- die Verbindungen Ib131.1-Ib131.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Propyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

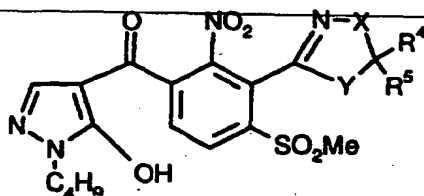


Ib131

30

- die Verbindungen Ib132.1-Ib132.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für n-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35



Ib132

40

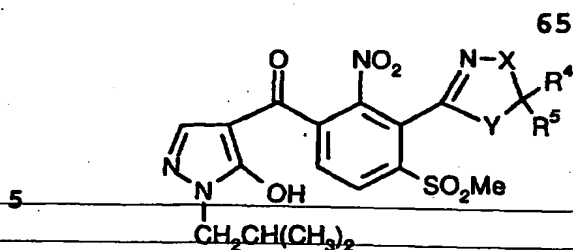
- die Verbindungen Ib133.1-Ib133.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für iso-Butyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

45

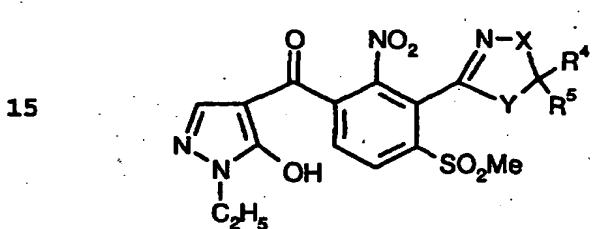
BASF Aktiengesellschaft

960970

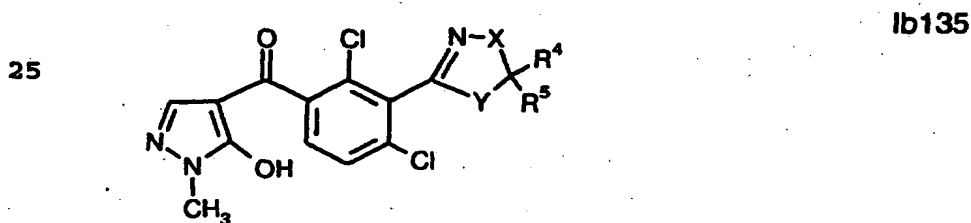
M 05.01.98



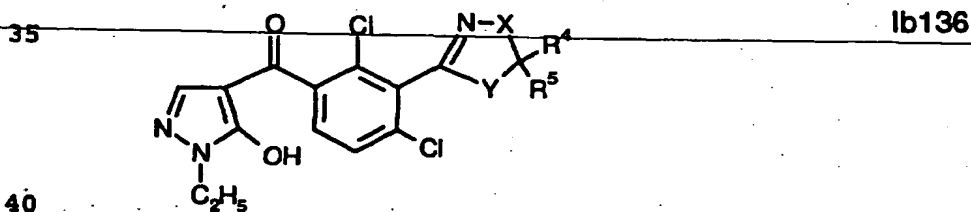
- 10 - die Verbindungen Ib134.1-Ib134.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



- 20 - die Verbindungen Ib135.1-Ib135.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{18} für Wasserstoff steht.



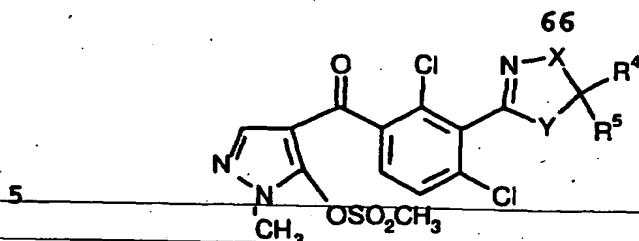
- 30 - die Verbindungen Ib136.1-Ib136.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



- 40 - die Verbindungen Ib137.1-Ib137.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

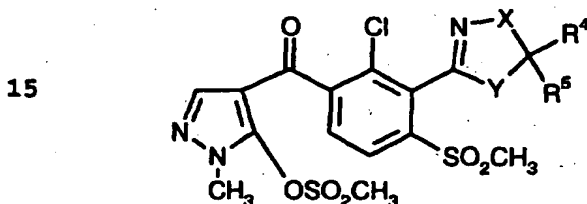
M 08.01.98

Ib137



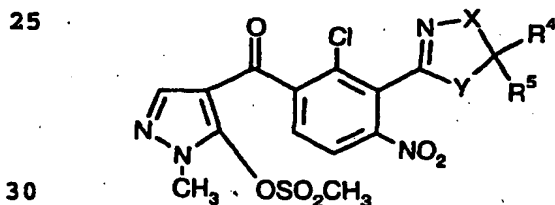
- 10 - die Verbindungen Ib138.1-Ib138.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib138



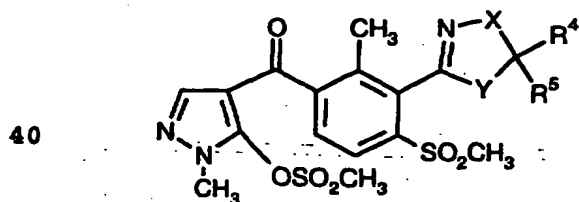
- 20 - die Verbindungen Ib139.1-Ib139.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib139



- 35 - die Verbindungen Ib140.1-Ib140.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib140



- 45 - die Verbindungen Ib141.1-Ib141.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

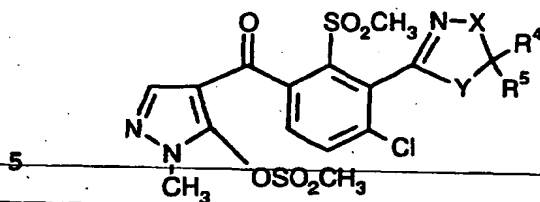
BASF Aktiengesellschaft

960970

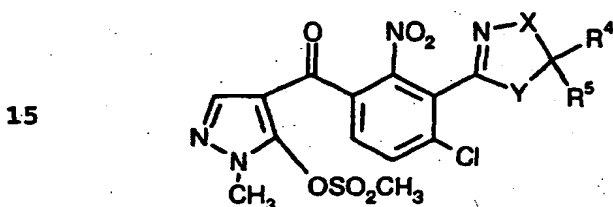
N 08.01.98

67

Ib141

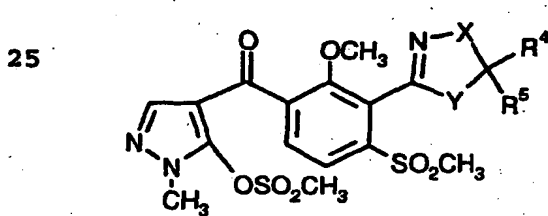


- 10 - die Verbindungen Ib142.1-Ib142.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



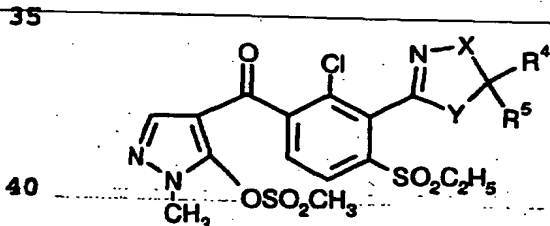
Ib142

- 20 - die Verbindungen Ib143.1-Ib143.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 und Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



Ib143

- 30 - die Verbindungen Ib144.1-Ib144.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



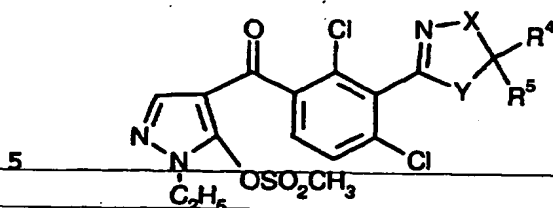
Ib144

- 40 - die Verbindungen Ib145.1-Ib145.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.
- 45

N 08.01.98

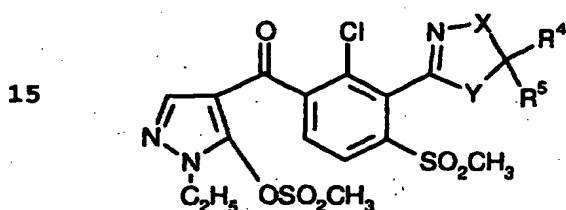
68

Ib145



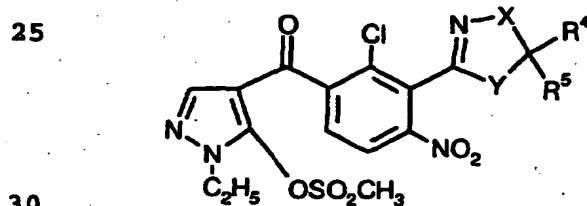
- 10 - die Verbindungen Ib146.1-Ib146.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib146



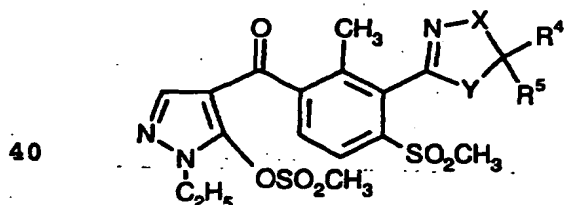
- 20 - die Verbindungen Ib147.1-Ib147.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib147



- 35 - die Verbindungen Ib148.1-Ib148.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib148



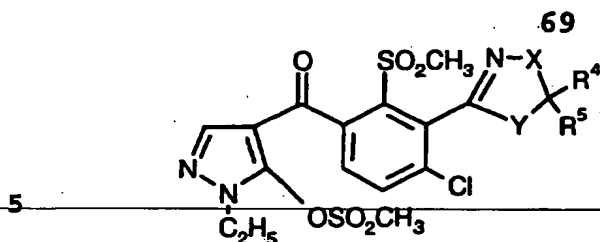
- 45 - die Verbindungen Ib149.1-Ib149.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

BASF Aktiengesellschaft

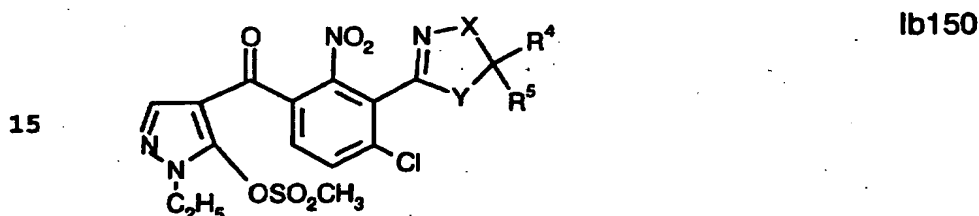
960970

N 08.01.98

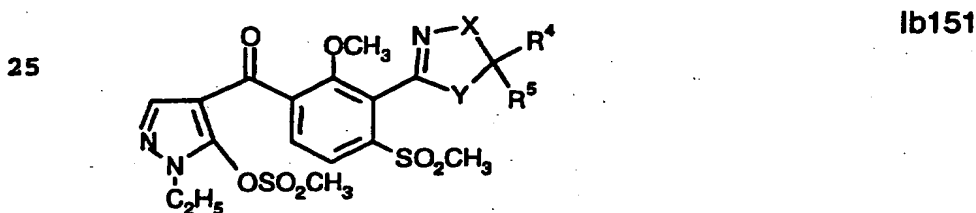
Ib149



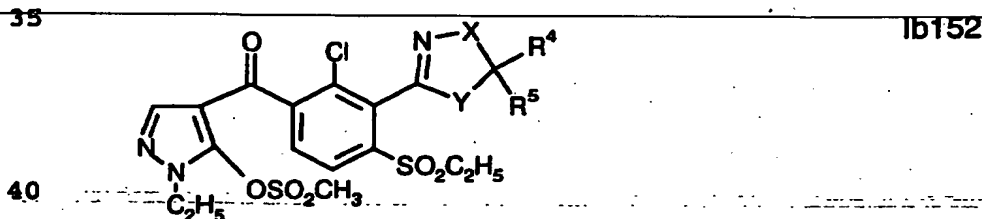
- 10
- die Verbindungen Ib150.1-Ib150.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



- 20
- die Verbindungen Ib151.1-Ib151.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



- 30
- die Verbindungen Ib152.1-Ib152.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



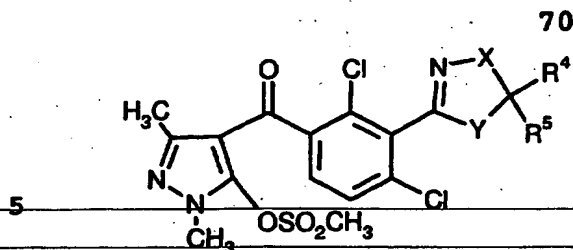
- 40
- die Verbindungen Ib153.1-Ib153.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Methylsulfonyl steht.
- 45

BASF Aktiengesellschaft

960970

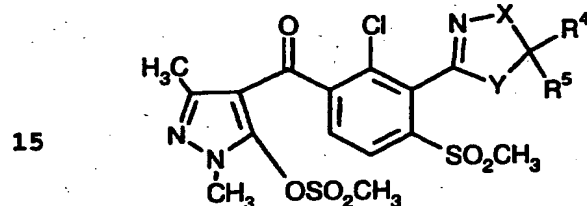
M 08.01.98

Ib153



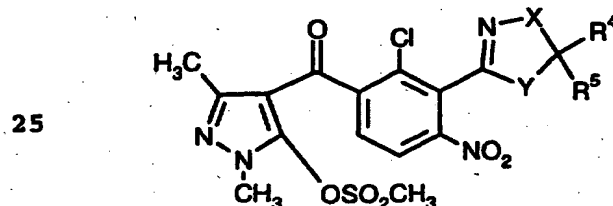
- 10 - die Verbindungen Ib154.1-Ib154.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 und Z für Methylsulfonyl stehen.

Ib154



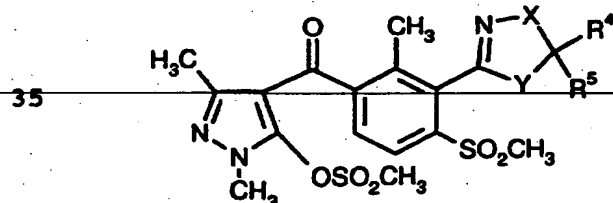
- 20 - die Verbindungen Ib155.1-Ib155.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro und Z für Methylsulfonyl stehen.

Ib155



- 30 - die Verbindungen Ib156.1-Ib156.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 und Z für Methylsulfonyl stehen.

Ib156



- 40 - die Verbindungen Ib157.1-Ib157.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 und Z für Methylsulfonyl stehen.

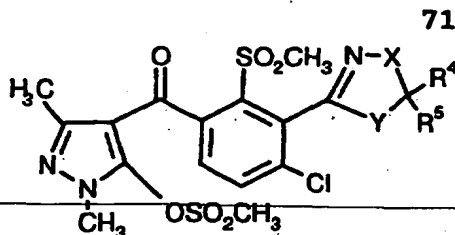
45

BASF Aktiengesellschaft

960970

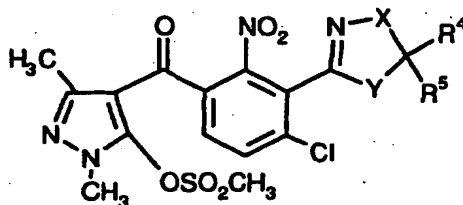
H 08.01.98

Ib157



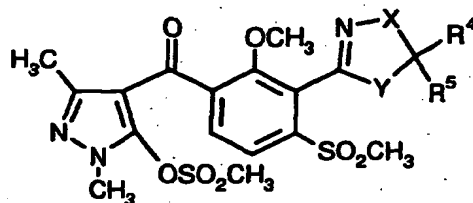
- 10 - die Verbindungen Ib158.1-Ib158.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro und Z für Methylsulfonyl stehen.

Ib158



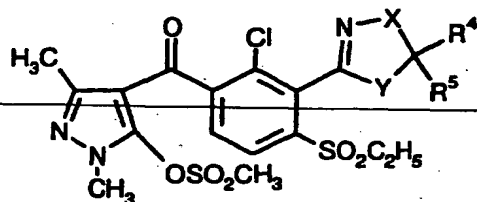
- 20 - die Verbindungen Ib159.1-Ib159.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² und Z für Methylsulfonyl stehen.

Ib159



- 30 - die Verbindungen Ib160.1-Ib160.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl und Z für Methylsulfonyl stehen.

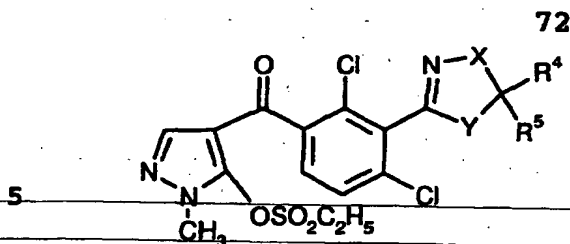
Ib160



- 40 - die Verbindungen Ib161.1-Ib161.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

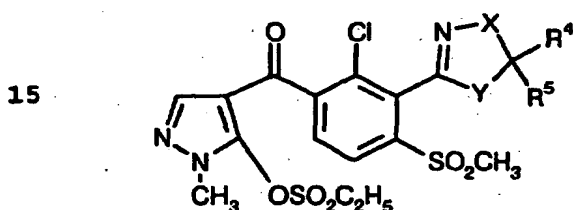
N 08.01.98

Ib161



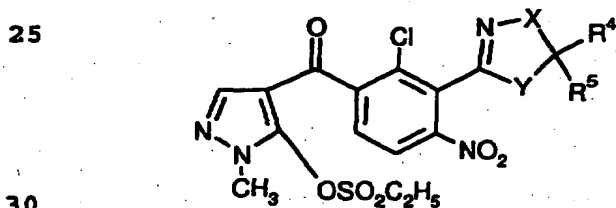
- 10 - die Verbindungen Ib162.1-Ib162.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib162



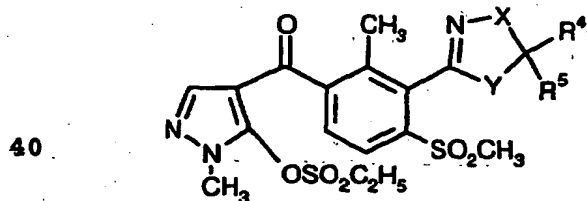
- 20 - die Verbindungen Ib163.1-Ib163.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib163



- 30 - die Verbindungen Ib164.1-Ib164.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib164



- 40
- 45 - die Verbindungen Ib165.1-Ib165.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

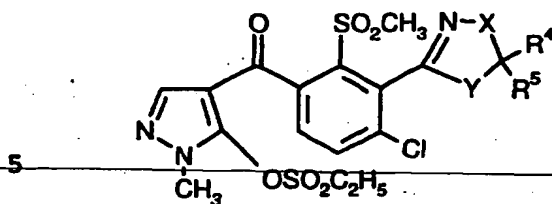
BASF Aktiengesellschaft

960970

H 08.01.98

73

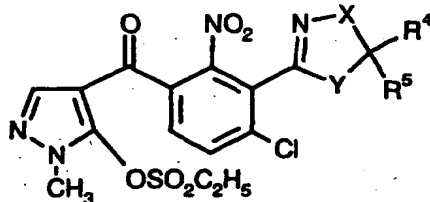
Ib165



10

- die Verbindungen Ib166.1-Ib166.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

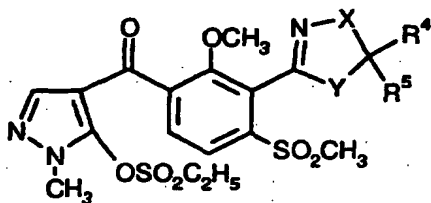


Ib166

20

- die Verbindungen Ib167.1-Ib167.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25



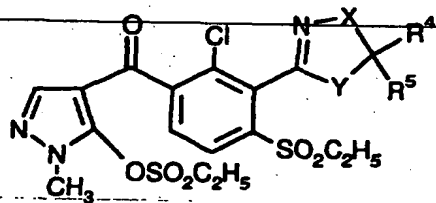
Ib167

30

- die Verbindungen Ib168.1-Ib168.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² und Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

Ib168



40

45

- die Verbindungen Ib169.1-Ib169.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

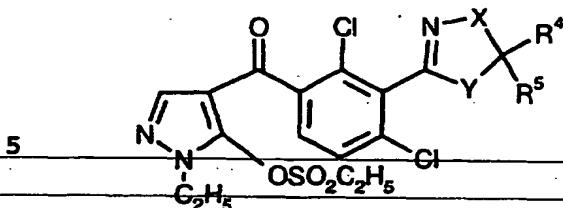
BASF Aktiengesellschaft

960970

M 08.01.98

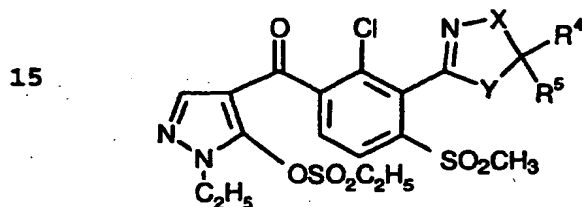
74

Ib169



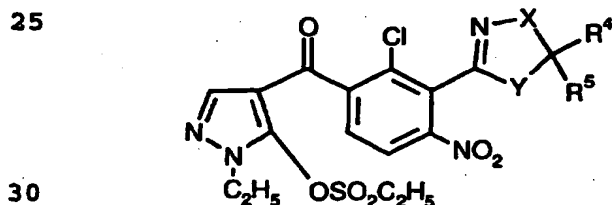
- 10 - die Verbindungen Ib170.1-Ib170.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib170



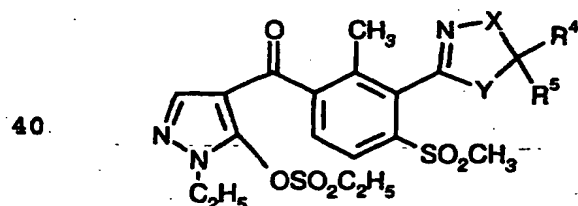
- 20 - die Verbindungen Ib171.1-Ib171.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib171



- 35 - die Verbindungen Ib172.1-Ib172.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib172



- 45 - die Verbindungen Ib173.1-Ib173.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

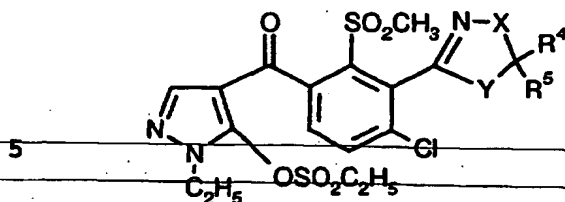
BASF Aktiengesellschaft

960970

N 08.01.98

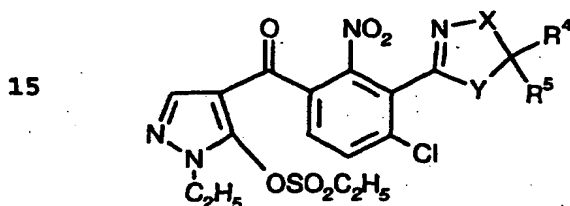
75

Ib173



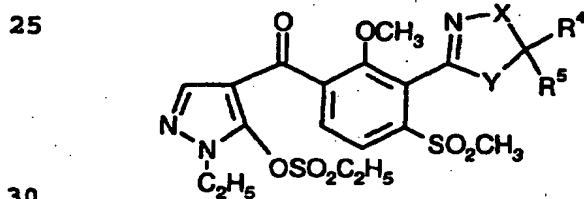
- 10 - die Verbindungen Ib174.1-Ib174.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib174



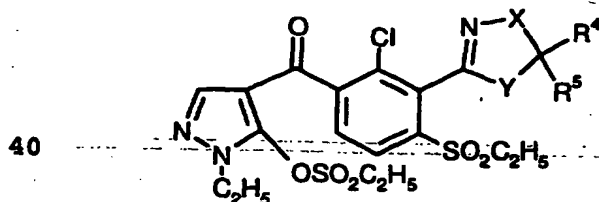
- 20 - die Verbindungen Ib175.1-Ib175.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib175



- 35 - die Verbindungen Ib176.1-Ib176.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib176



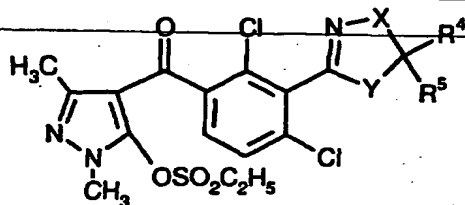
N 08.01.98

76

- die Verbindungen Ib177.1-Ib177.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Ethylsulfonyl steht.

5

10

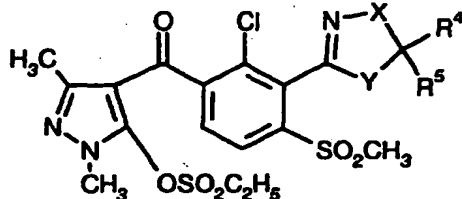


Ib177

15

- die Verbindungen Ib178.1-Ib178.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

20

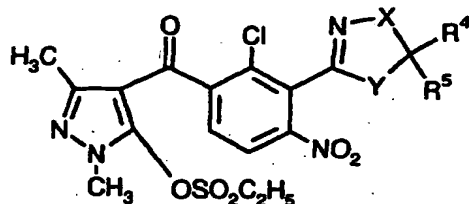


Ib178

25

- die Verbindungen Ib179.1-Ib179.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro und Z für Ethylsulfonyl stehen.

30

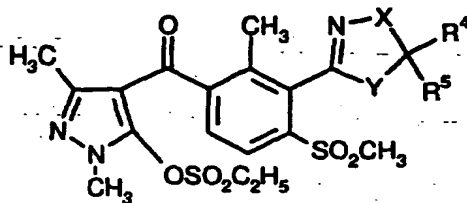


Ib179

35

- die Verbindungen Ib180.1-Ib180.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

40



Ib180

45

H 000198

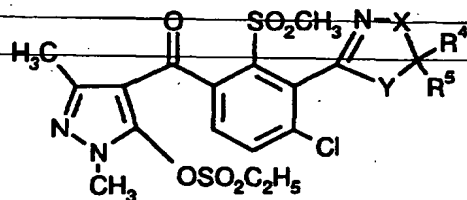
77

- die Verbindungen Ib181.1-Ib181.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

5

Ib181

10

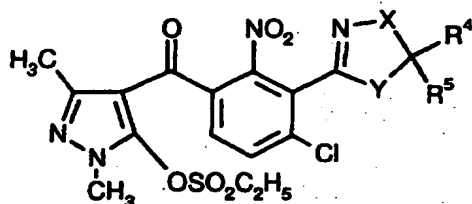


- die Verbindungen Ib182.1-Ib182.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro und Z für Ethylsulfonyl stehen.

15

Ib182

20

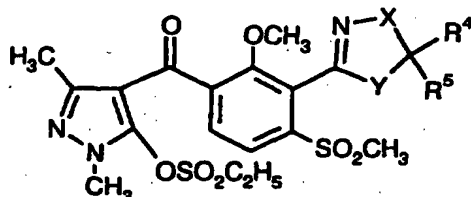


25

- die Verbindungen Ib183.1-Ib183.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

30

Ib183

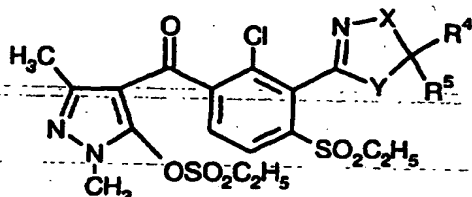


35

- die Verbindungen Ib184.1-Ib184.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 und Z für Ethylsulfonyl stehen.

Ib184

40



45

- die Verbindungen Ib185.1-Ib185.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für iso-Propylsulfonyl und R^{10} für Wasserstoff stehen.

BASF Aktiengesellschaft

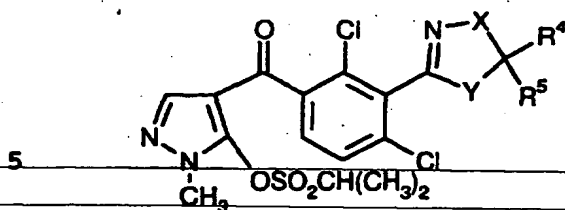
960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

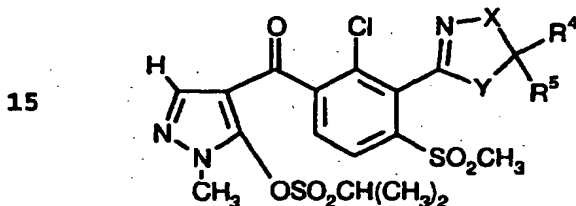
78

Ib185



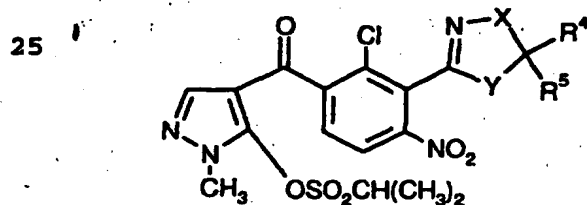
- 10 - die Verbindungen Ib186.1-Ib186.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib186



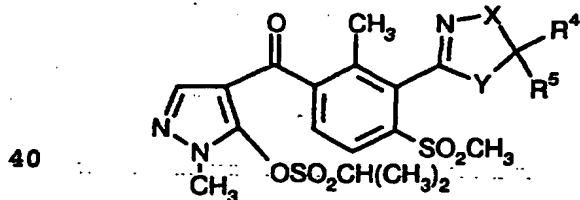
- 20 - die Verbindungen Ib187.1-Ib187.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib187



- 30 - die Verbindungen Ib188.1-Ib188.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib188



- 40 - die Verbindungen Ib189.1-Ib189.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.
- 45

BASF Aktiengesellschaft

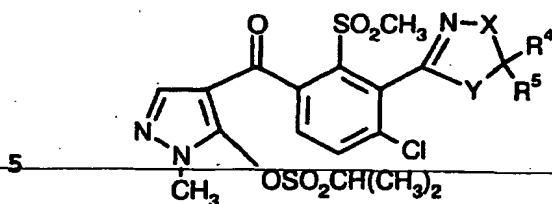
960970

O.Z. 0050/47679

H 08.01.98

79

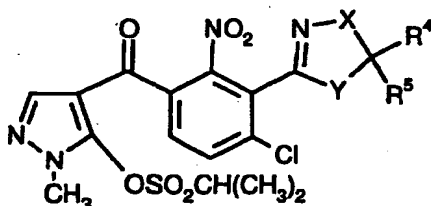
Ib189



10

- die Verbindungen Ib190.1-Ib190.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

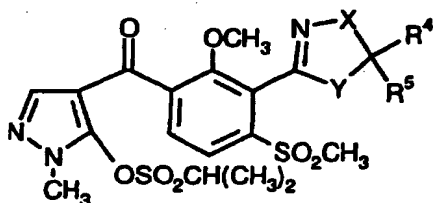


Ib190

20

- die Verbindungen Ib191.1-Ib191.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25



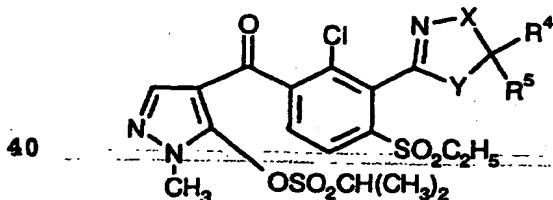
Ib191

30

- die Verbindungen Ib192.1-Ib192.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

Ib192

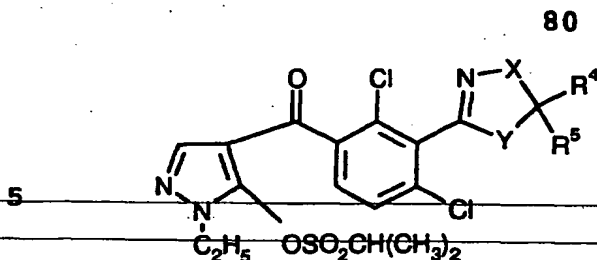


45

- die Verbindungen Ib193.1-Ib193.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

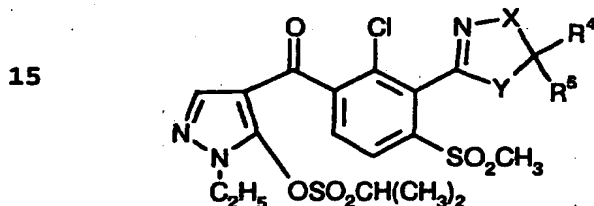
H 08.01.98

Ib193



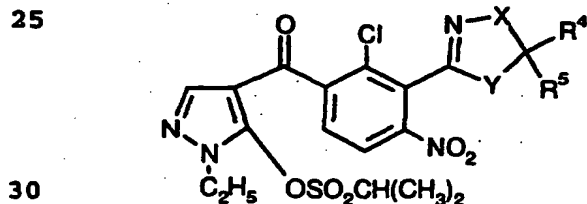
- 10 - die Verbindungen Ib194.1-Ib194.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib194



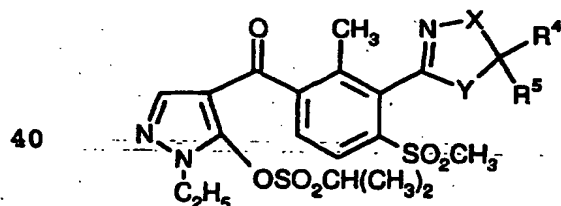
- 20 - die Verbindungen Ib195.1-Ib195.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib195



- 35 - die Verbindungen Ib196.1-Ib196.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib196



- 45 - die Verbindungen Ib197.1-Ib197.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

BASF Aktiengesellschaft

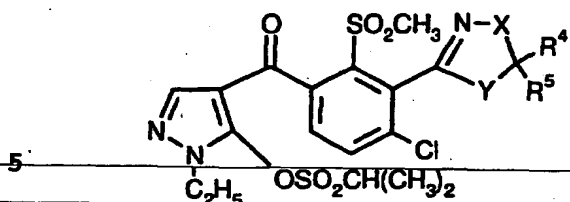
960970

O.Z. 0050/47679

H 08.01.98

Ib197

81

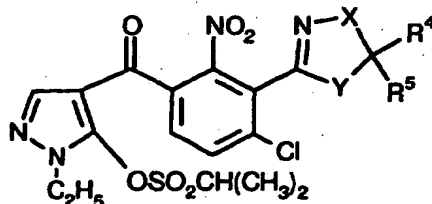


10

die Verbindungen Ib198.1-Ib198.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib198

15

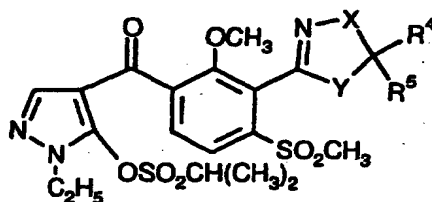


20

die Verbindungen Ib199.1-Ib199.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib199

25

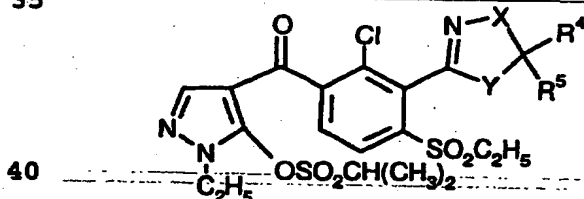


30

die Verbindungen Ib200.1-Ib200.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib200

35



40

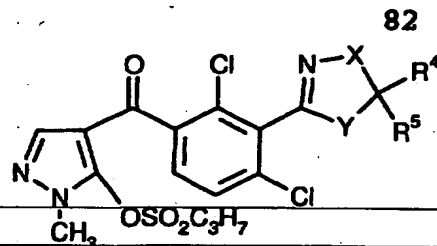
die Verbindungen Ib201.1-Ib201.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

45

11 08.01.98

Ib201

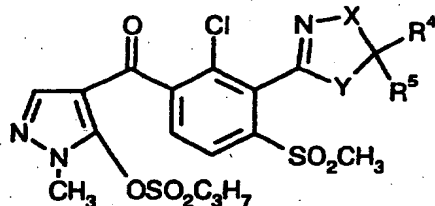
5



10

- die Verbindungen Ib202.1-Ib202.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

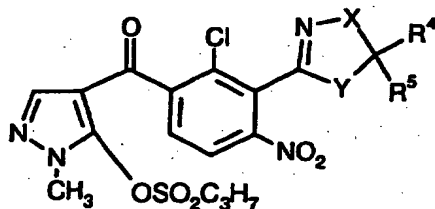


Ib202

20

- die Verbindungen Ib203.1-Ib203.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

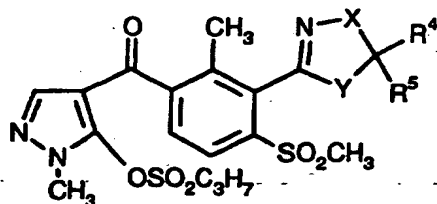


Ib203

30

- die Verbindungen Ib204.1-Ib204.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35



Ib204

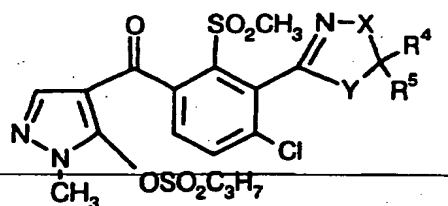
40

45

- die Verbindungen Ib205.1-Ib205.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

M 08.01.98

Ib205

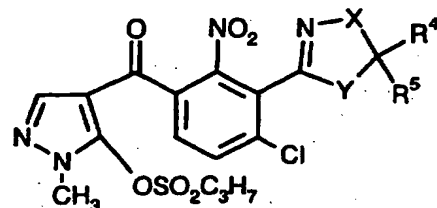


5

10

- die Verbindungen Ib206.1-Ib206.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib206

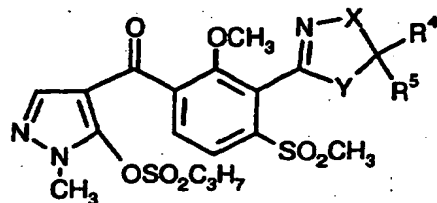


15

20

- die Verbindungen Ib207.1-Ib207.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib207

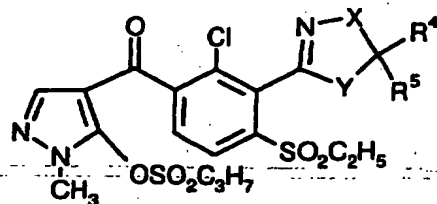


25

30

- die Verbindungen Ib.208.1-Ib208.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib208



40

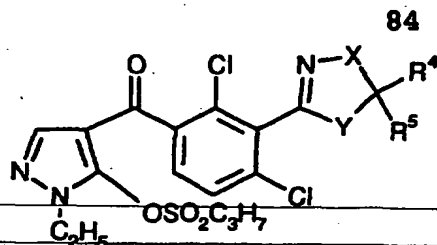
45

- die Verbindungen Ib209.1-Ib209.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

H 08.01.98

Ib209

5

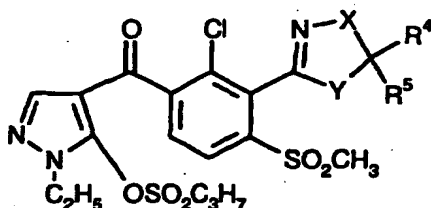


10

- die Verbindungen Ib210.1-Ib210.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib210

15

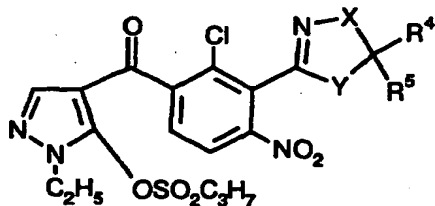


20

- die Verbindungen Ib211.1-211.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib211

25



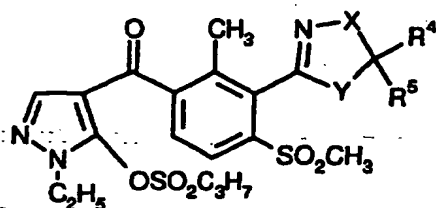
30

- die Verbindungen Ib212.1-Ib212.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

Ib212

40



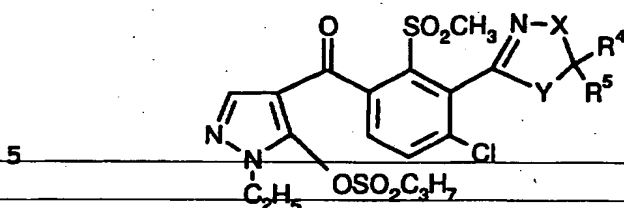
45

- die Verbindungen Ib213.1-Ib213.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

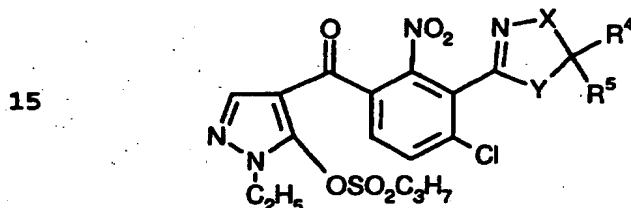
H 08.01.98

85

Ib213

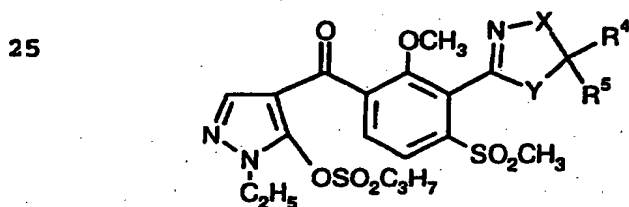


- 10 - die Verbindungen Ib214.1-Ib214.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



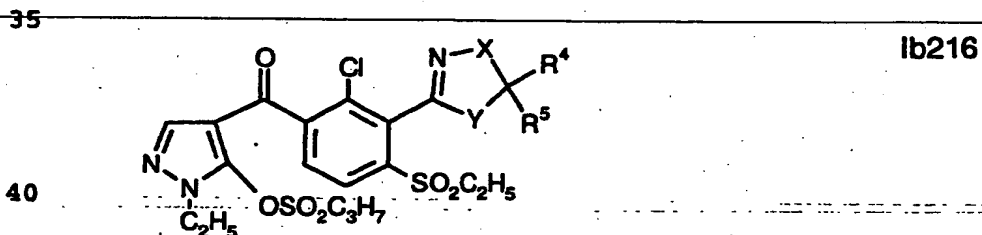
Ib214

- 20 - die Verbindungen Ib215.1-Ib215.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib215

- 30 - die Verbindungen Ib216.1-Ib216.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib216

- 40 - die Verbindungen Ib217.1-Ib217.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.
- 45

BASF Aktiengesellschaft

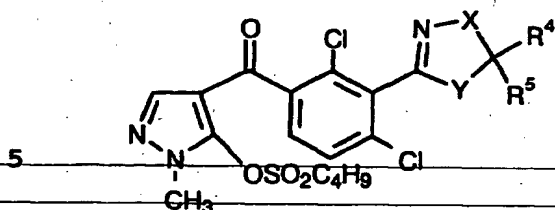
960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

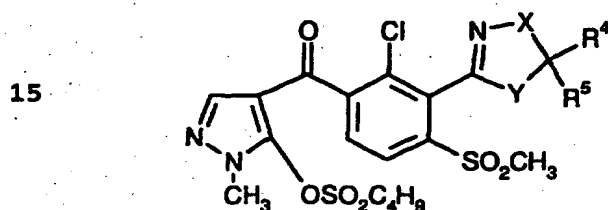
86

Ib217



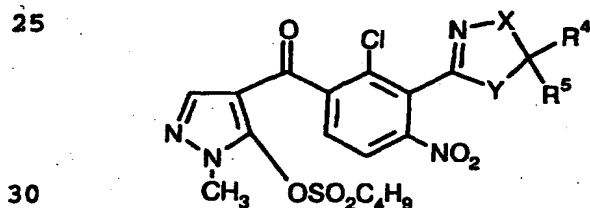
- 10 - die Verbindungen Ib218.1-Ib218.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib218



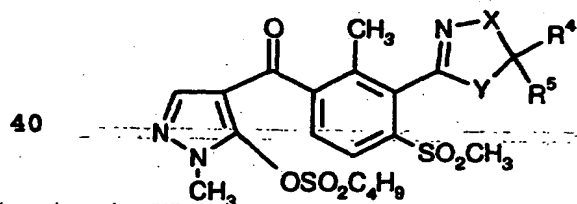
- 20 - die Verbindungen Ib219.1-Ib219.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib 219



- 35 - die Verbindungen Ib220.1-Ib220.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib220



- 45 - die Verbindungen Ib221.1-Ib221.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

BASF Aktiengesellschaft

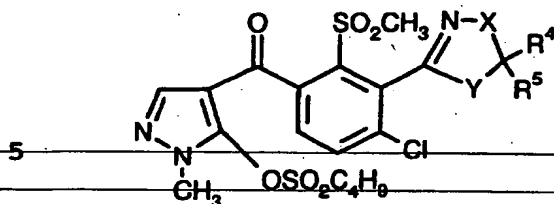
960970

O.Z. 0050/47679

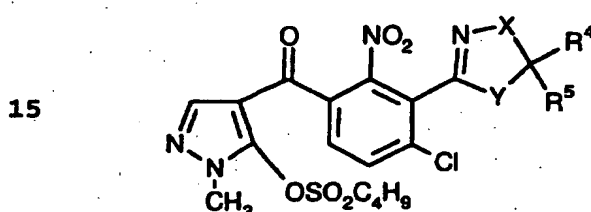
N 000198

87

Ib221

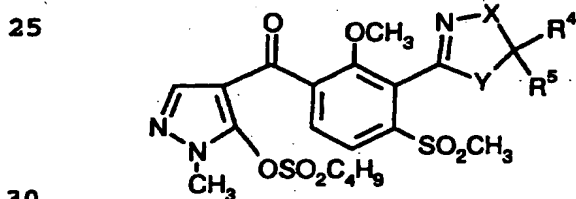


- 10 - die Verbindungen Ib222.1-Ib222.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib222

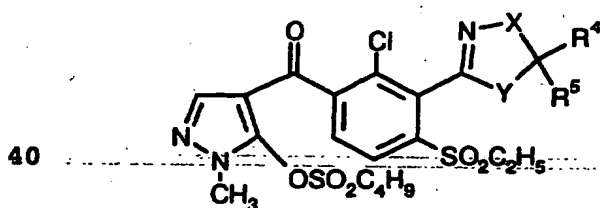
- 20 - die Verbindungen Ib223.1-Ib223.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib223

- 30 - die Verbindungen Ib224.1-Ib224.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

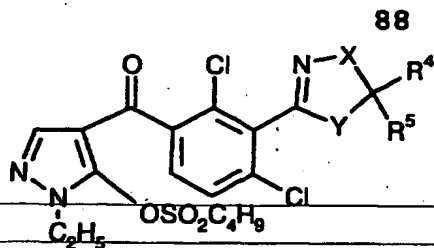


Ib224

- 45 - die Verbindungen Ib225.1-Ib225.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

H 000190

5

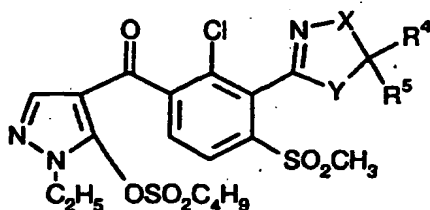


Ib225

10

- die Verbindungen Ib226.1-Ib226.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

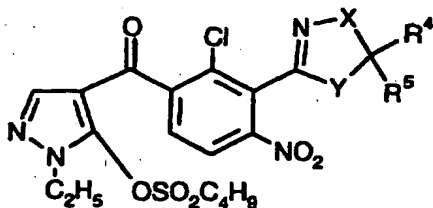


Ib226

20

- die Verbindungen Ib227.1-Ib227.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25



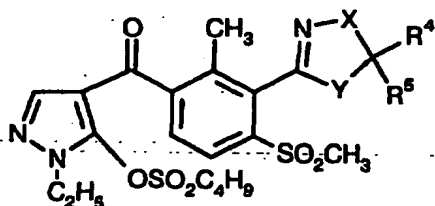
Ib227

30

- die Verbindungen Ib228.1-Ib228.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

40



Ib228

45

- die Verbindungen Ib229.1-Ib229.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

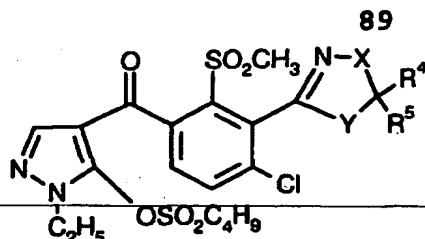
BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 000190

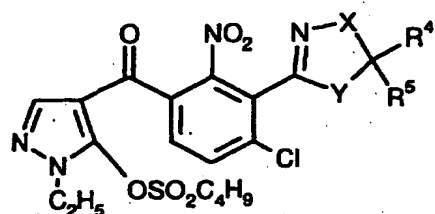
Ib229



5

- 10 - die Verbindungen Ib230.1-Ib230.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

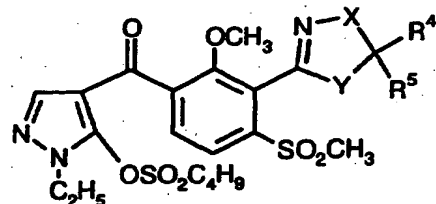
Ib230



15

- 20 - die Verbindungen Ib231.1-Ib231.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib231

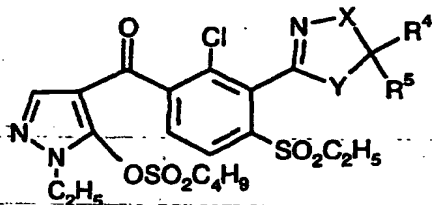


25

30

- 35 - die Verbindungen Ib232.1-Ib232.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib232



40

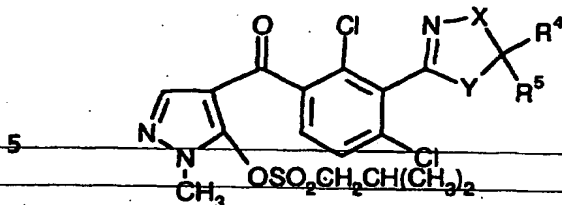
- 45 - die Verbindungen Ib233.1-Ib233.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

H

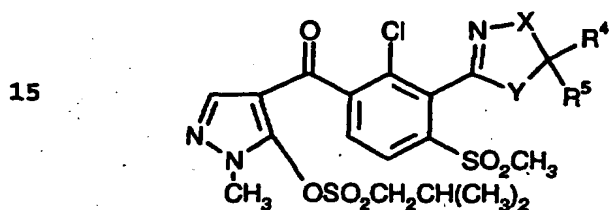
0050190

90

Ib233

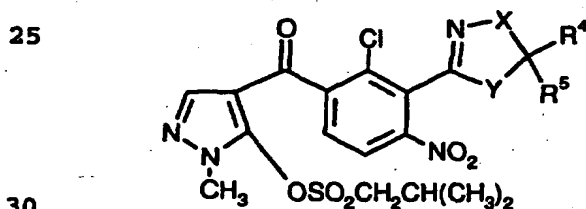


- 10 - die Verbindungen Ib234.1-Ib234.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



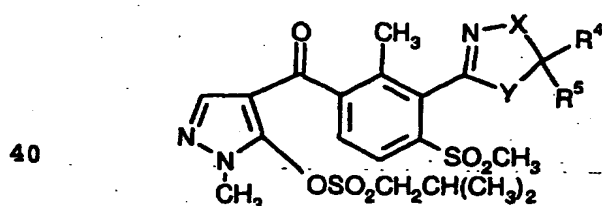
Ib234

- 20 - die Verbindungen Ib235.1-Ib235.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib235

- 35 - die Verbindungen Ib236.1-Ib236.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



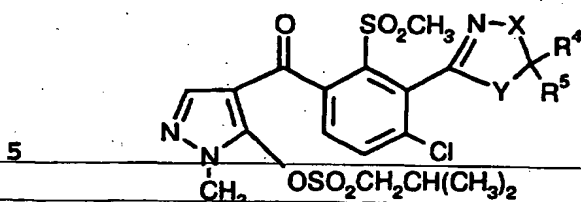
Ib236

- 45 - die Verbindungen Ib237.1-Ib237.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

N 08.01.98

91

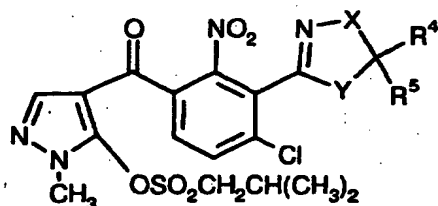
Ib237



10

- die Verbindungen Ib238.1-Ib238.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

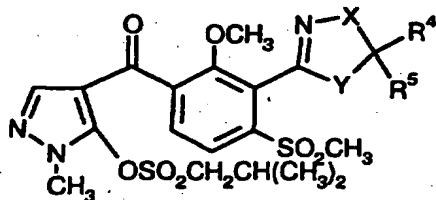


Ib238

20

- die Verbindungen Ib239.1-Ib239.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25



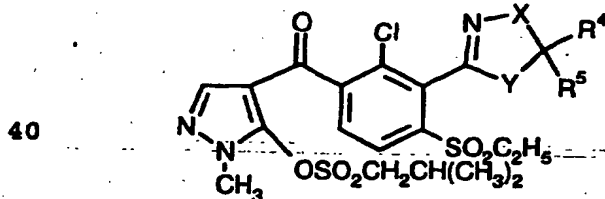
Ib239

30

- die Verbindungen Ib240.1-Ib240.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

Ib240



40

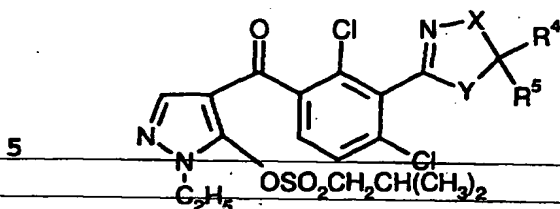
45

- die Verbindungen Ib241.1-Ib241.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

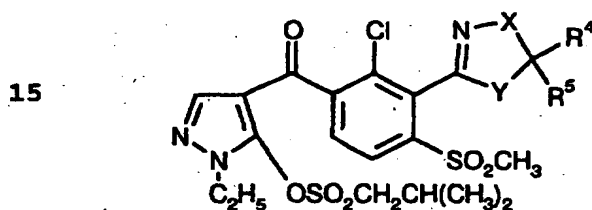
11 08 01 98

92

Ib241

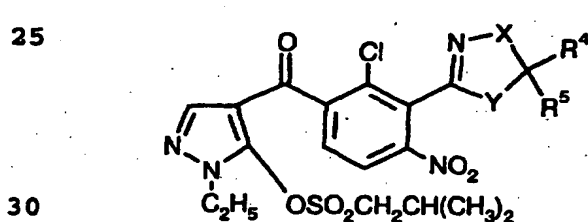


- 10 - die Verbindungen Ib242.1-Ib242.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



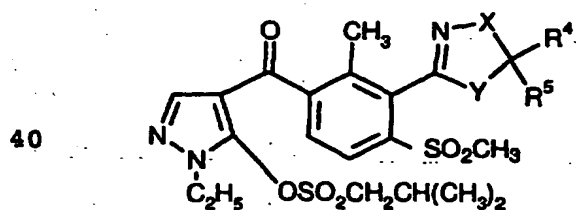
Ib242

- 20 - die Verbindungen Ib243.1-Ib243.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib243

- 35 - die Verbindungen Ib244.1-Ib244.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



Ib244

- 45 - die Verbindungen Ib245.1-Ib245.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

BASF Aktiengesellschaft

960970

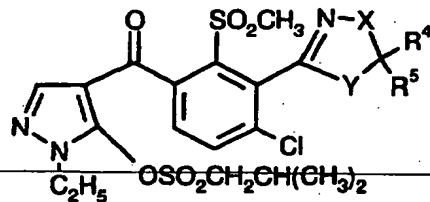
O.Z. 0050/47679

H 000190

93

Ib245

5

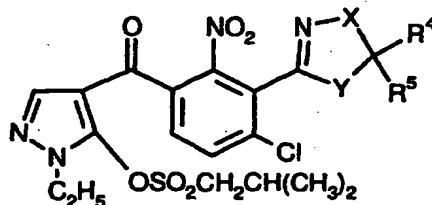


10

- die Verbindungen Ib246.1-Ib246.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib246

15

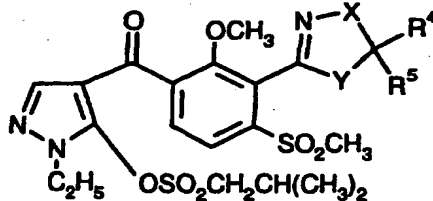


20

- die Verbindungen Ib247.1-Ib247.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib247

25

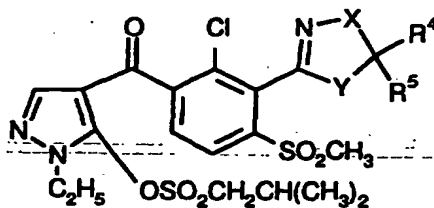


30

- die Verbindungen Ib248.1-Ib248.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

Ib248

40



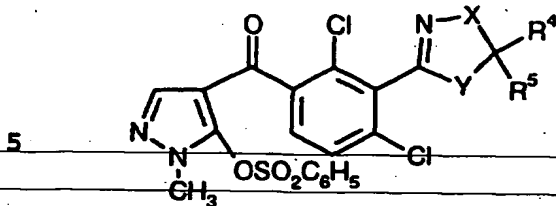
45

- die Verbindungen Ib249.1-Ib249.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

0. Z. 0050/47679

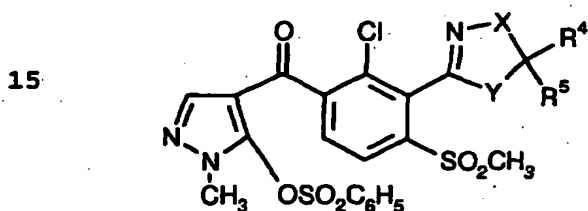
94

1b249



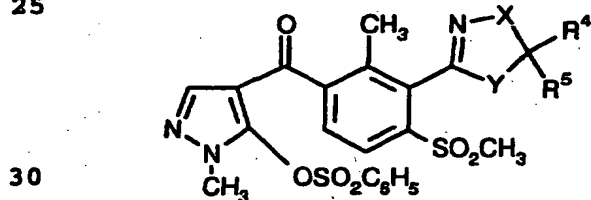
- 10 - die Verbindungen Ib250.1-Ib250.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

b250



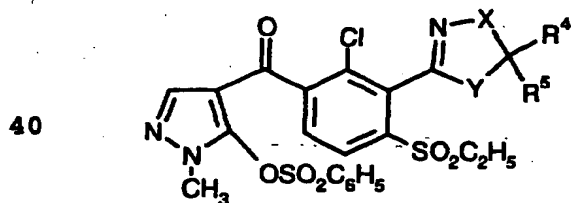
- 20 - die Verbindungen Ib251.1-Ib251.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

b251



- die Verbindungen Ib252.1-Ib252.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

1b252



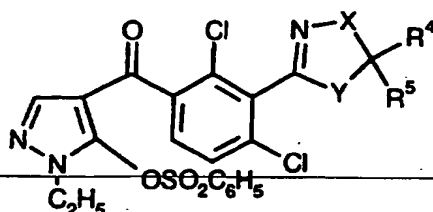
- 45 - die Verbindungen Ib253.1-Ib253.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

H 050190

95

Ib253

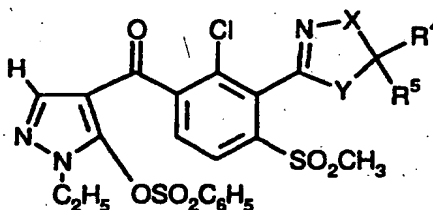
5



10

- die Verbindungen Ib254.1-Ib254.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

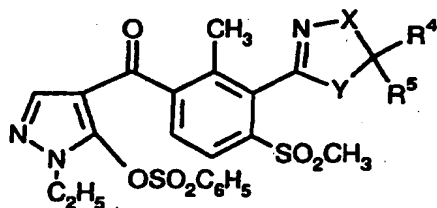


Ib254

20

- die Verbindungen Ib255.1-Ib255.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25



Ib255

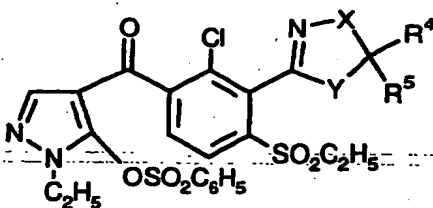
30

- die Verbindungen Ib256.1-Ib256.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

Ib256

40



45

- die Verbindungen Ib257.1-Ib257.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für p-Toluolsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

96

CN1C=CC2=C1C(=O)C3=C(C=C(C=C3)Cl)C(=N2)C(=N4C(C)(C4)X)Y

5

CH₃ OSO₂(4-CH₃-C₈H₄)

15

CN1C=CC2=C1C(=O)C3=CC=C(C=C3)C(Cl)=C(C=C3)C(=N2)C(=N3C(=C(C=C3)C(=O)O)S(=O)(=O)C)C(=N3)C4(C)C(C)C(C)C4

25

CN1C=CC(=O)C1C(=O)c2cc(C)c(cc2C(S)(=O)OC)C(=NX)Y(C)(R5)R4

30

~~35~~

40

Chemical structure 40: A benzimidazole derivative. The benzimidazole ring system has a methyl group (CH₃) at position 2 and a carbonyl group (C=O) at position 3. The benzene ring is substituted at position 4 with a chlorine atom (Cl), at position 5 with a sulfonamide group (SO₂C₂H₅), and at position 6 with a 1,3,4-oxadiazole ring. The 1,3,4-oxadiazole ring has substituents X and Y at positions 4 and 5, and R⁴ and R⁵ at position 3.

40

45 - die Verbindungen Ib261.1-Ib261.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

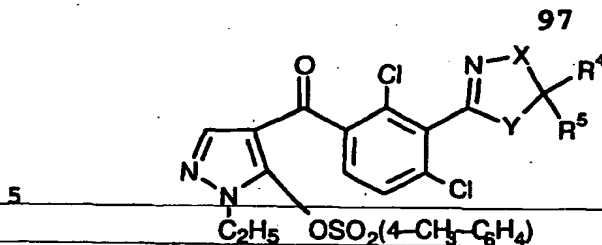
BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 000190

Ib261

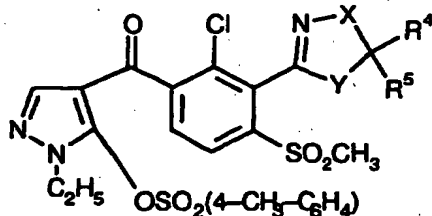


- 10 - die Verbindungen Ib262.1-Ib262.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib262

20

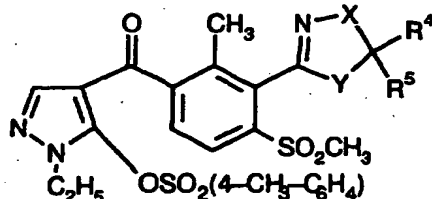


- die Verbindungen Ib263.1-Ib263.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib263

30

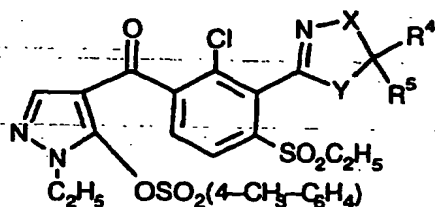


- 35 - die Verbindungen Ib264-Ib264.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib264

45



BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

98

Die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzolylderivate der Formel I sind auf verschiedene Art und Weise erhältlich, beispielsweise nach folgendem Verfahren:

5

Verfahren A:

Umsetzung von Pyrazolen der Formel II (mit $Z = H$) mit einer aktivierten Benzoessäure III α oder einer Benzoessäure III β , die vorzugsweise in situ aktiviert wird, zu dem Acylierungsprodukt und anschließende Umlagerung.

15

20

25

30

35

40

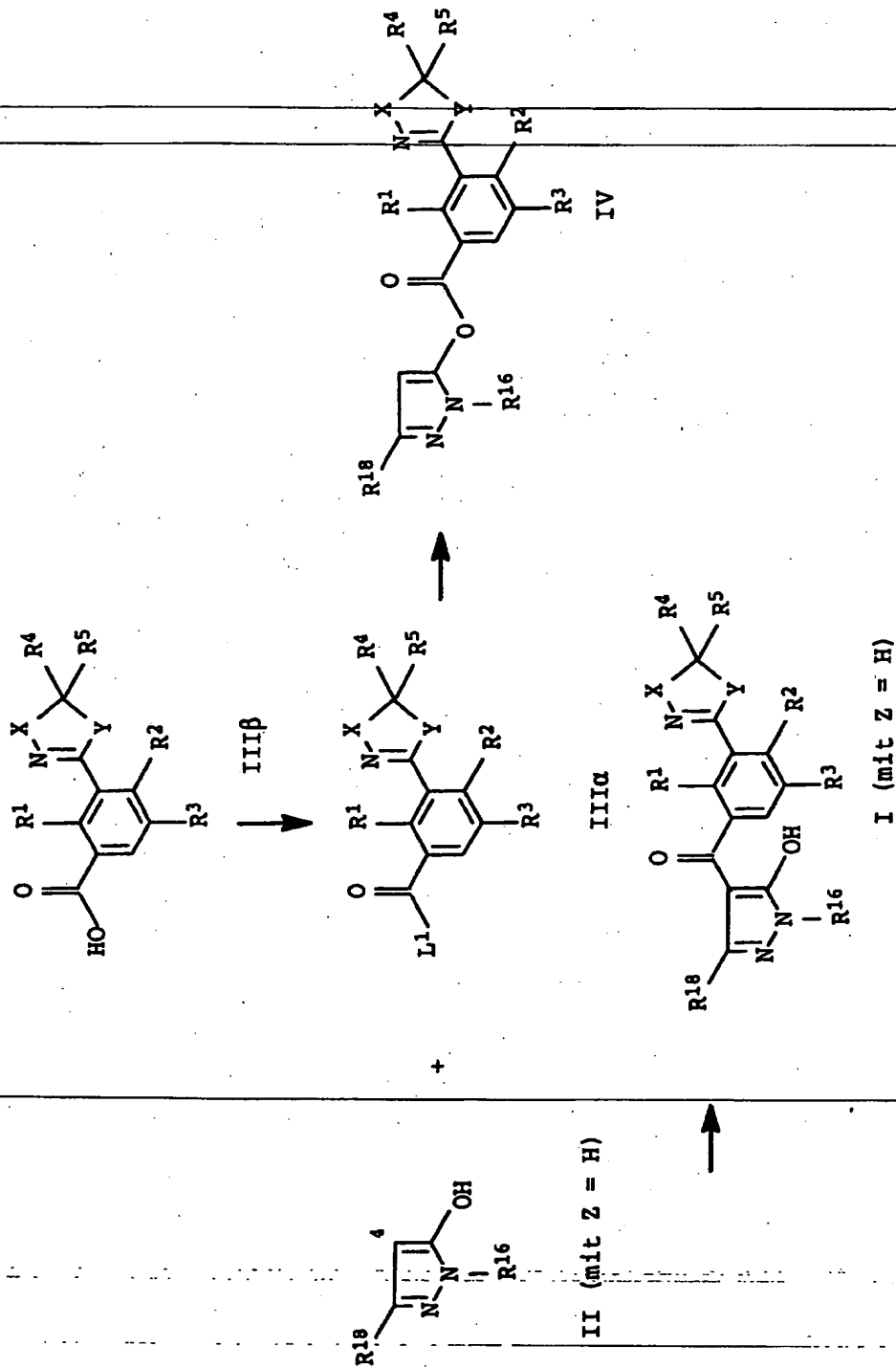
45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O. Z. 0050/42679

99



H 000190

100

L¹ steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen z.B. Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Carboxylat, z.B. Acetat, Trifluoracetat etc.

5

Die aktivierte Benzoessäure kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Benzoylhalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. mit Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäureester, 2-Pyridindisulfid/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

10

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,2 bis 1,5 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäureethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Benzoylhalogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reaktionspartners die Reaktionsmischung auf 0-10°C abzukühlen. Anschließend rührt man bei 20 - 100°C, vorzugsweise bei 25 - 50°C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäureethylester.

~~35 Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels kann der rohe Ester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden.~~

Die Umlagerung der Ester zu den Verbindungen der Formel I erfolgt zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 40°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 000190

101

Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

5

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin oder Alkalicarbonat, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt werden Triethylamin oder Alkalicarbonat verwendet, vorzugsweise in doppelt äquimolarem Verhältnis in Bezug auf den Ester.

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid, Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie Acetoncyanhydrin, Trimethylsilylcyanid in Betracht. Sie werden in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z.B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise 10 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

20

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das Reaktionsgemisch wird z.B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methylenchlorid, Essigsäureethylester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5-10%iger Alkalicarbonatlösung, z.B. Natriumcarbonat-, Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingeengt.

30 (Beispiele für die Darstellung von Estern von Hydroxypyrazolen und für die Umlagerung der Ester sind z.B. in EP-A 282 944 und US 4 643 757 genannt).

Verfahren B:

35

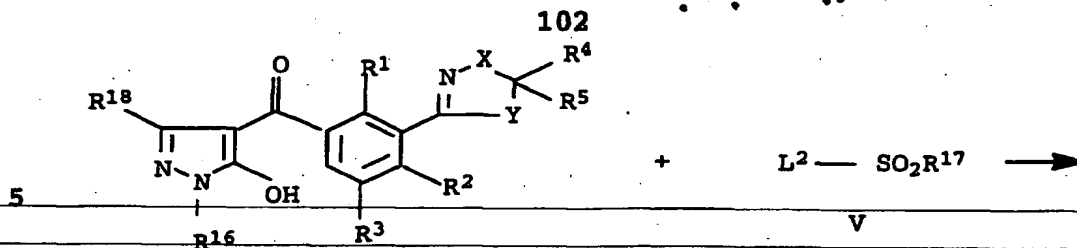
Umsetzung von 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I (mit $Z = H$) mit einer Verbindung der Formel V (mit $Z = SO_2R^{17}$):

40

45

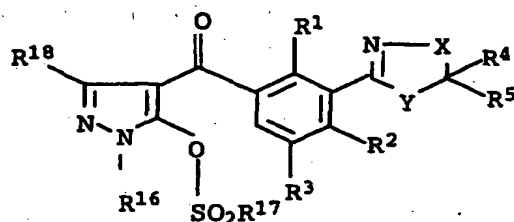
M

08.01.90



10

15



- 20 L² steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen, z.B. Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Sulfonat, z.B. OSO₂R¹⁷.

Die Verbindungen der Formel V können direkt eingesetzt werden, wie z.B. im Fall der Sulfonsäurehalogenide, Sulfonsäureanhydride oder in situ erzeugt werden, z.B. aktivierte Sulfonsäuren (mittels Sulfonsäure und Dicyclohexylcarbonyldiimid, Carbonyldiimidazol etc.).

- 30 Die Ausgangsverbindungen werden in der Regel im äquimolaren Verhältnis eingesetzt. Es kann aber auch von Vorteil sein, die eine oder andere Komponente im Überschuß einzusetzen.

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung in Gegenwart einer Base durchzuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,5 bis 3 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

- 40 Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, wie Triethylamin, Pyridin, Alkalimetallcarbonate, z.B. Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Alkalimetallhydride, z.B. Natriumhydrid. Bevorzugt verwendet werden Triethylamin und Pyridin.

- 45 Als Lösungsmittel kommen z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether,

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 050190

103

Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester, wie Essigsäureethylester, oder Gemische hiervon in Betracht.

5

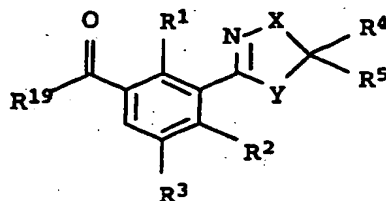
In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise zum Produkt hin 10 erfolgen.

Die als Ausgangsmaterialien verwendeten Pyrazole der Formel II (mit Z = H) sind bekannt oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (z.B. EP-A 240 001 und J. Prakt. Chem. 15 315, 383 (1973)).

3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäurederivate der Formel III sind neu,

20



25

III

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben.

30 R¹, R² Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

35

R³ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, 40 Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, 45 C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei

N 050198

104

die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

- 5 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

oder

- 10 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

15 oder

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

- 20 R⁶ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR⁷R⁸;

R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

25

R⁸ C₁-C₄-Alkyl;

X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

30 Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

- R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl oder CONR⁷R⁸;

35

oder

- 40 R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

45

R¹⁹ Hydroxy oder abhydrolysierbarer Rest;

M 08.01.90

105

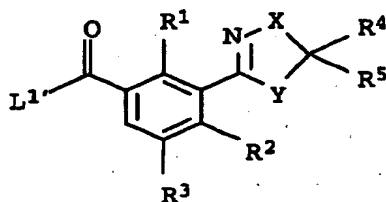
mit Ausnahme von 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 2-Chlor-3-(4,5-dihydro-oxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

5 Beispiele für abhydrolysierbare Reste sind Alkoxy-, Phenoxy-, Alkylthio-, Phenylthio-Reste, die gegebenenfalls substituiert sein können, Halogenide, Hetarylreste, die über Stickstoff gebunden sind, Amino, Imino-Reste, die gegebenenfalls substituiert sein können etc.

10

Bevorzugt sind 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäurehalogenide der Formel IIIa', mit L¹' = Halogen ($\hat{=}$ III mit R¹⁹ = Halogen),

15



20

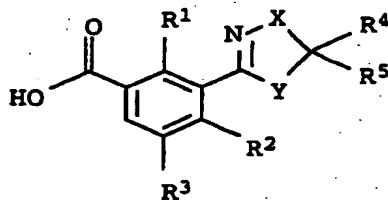
IIIa'

wobei die Variablen R¹ bis R⁵, X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

25 L¹' Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäuren der Formel IIIβ ($\hat{=}$ III mit R¹⁹ = Hydroxy),

30



35

IIIβ

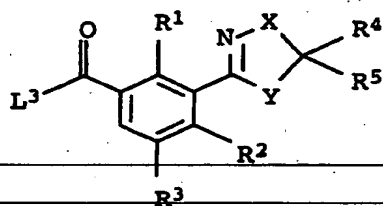
wobei die Variablen R¹ bis R⁵, X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben.

40

Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäure-ester der Formel IIIγ ($\hat{=}$ III mit R¹⁹ = C₁-C₆-Alkoxy),

45

106



5

IIIy

10 wobei die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

L^3 C_1 - C_6 -Alkoxy bedeutet.

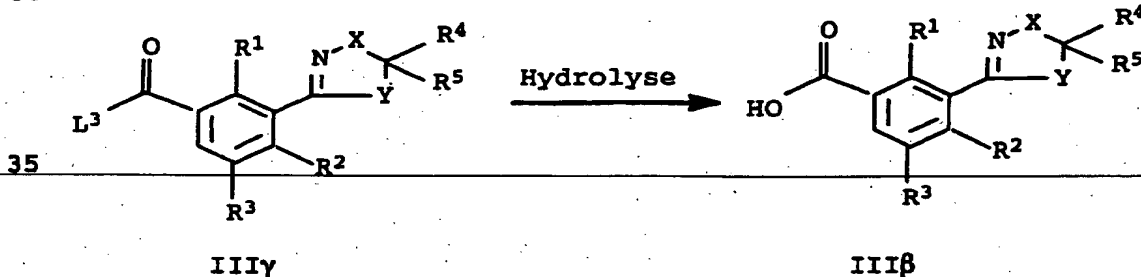
15 Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der 3-Heteroacycyl-substituierten Benzoesäurederivate der Formel III in Bezug auf die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y entsprechen denen der 3-Heterocycl-substituierten Benzoylderivate der Formel I.

20 Die Benzoylhalogenide der Formel III α' (mit $L^1 = Cl, Br,$) können auf an sich bekannte Art und Weise durch Umsetzung der Benzoesäuren der Formel III β mit Halogenierungsreagentien wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Oxalylchlorid, Oxalylbromid hergestellt werden.

25

Die Benzoesäuren der Formel III β können in bekannter Weise durch saure oder basische Hydrolyse aus den entsprechenden Estern der Formel IIIy ($L^3 = C_1$ - C_6 -Alkoxy) hergestellt werden.

30

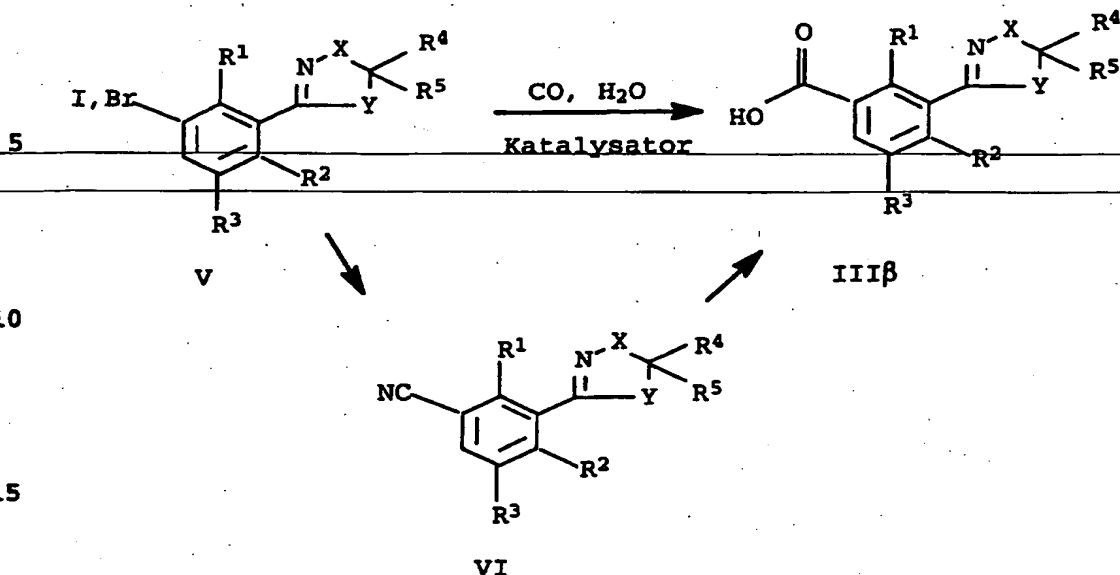


40 Ebenso können die Benzoesäuren der Formel III β durch Umsetzung von entsprechenden Brom- oder Iod-substituierten Verbindungen der Formel V, in Gegenwart eines Palladium-, Nickel-, Cobalt- oder Rhodium-Übergangsmetallkatalysators und einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser unter erhöhtem Druck erhalten werden.

45

M 08.01.98

107



Weiterhin ist es möglich durch Rosenmund-von Braun-Reaktion

20 Verbindungen der Formel V in die entsprechenden Nitrile der Formel VI zu überführen (vgl. z.B. Org. Synth. Bd III, 212 (1955)) und diese durch nachfolgende Verseifung in die Verbindungen der Formel IIIβ umzuwandeln.

25 Die Ester der Formel IIIγ können durch Umsetzung von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten der Formel VII, wobei L⁴ für eine Ausgangsgruppe wie Brom, Iod, Triflat, Fluorsulfonyloxy etc. steht, mit Heterocyclyl-Stannaten (Stille-Kupplungen), Heterocyclyl-Borverbindungen (Suzuki-Kupplungen) oder Heterocyclyl-Zink-

30 verbindungen (Negishi-Reaktion) VIII, wobei M entsprechend für Sn(C₁-C₄-Alkyl)₃, B(OH)₂, ZnHal (mit Hal = Chlor, Brom) etc. steht, auf an sich bekannte Art und Weise (vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 27, 5269 (1986) in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysator und gegebenenfalls einer Base erhalten

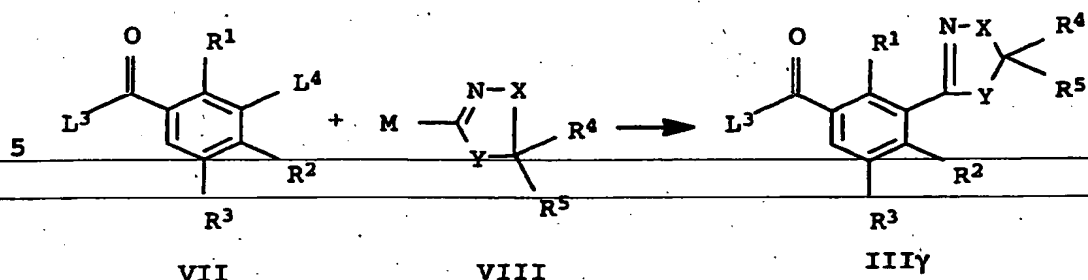
35 werden.

40

45

M 08.01.98

108

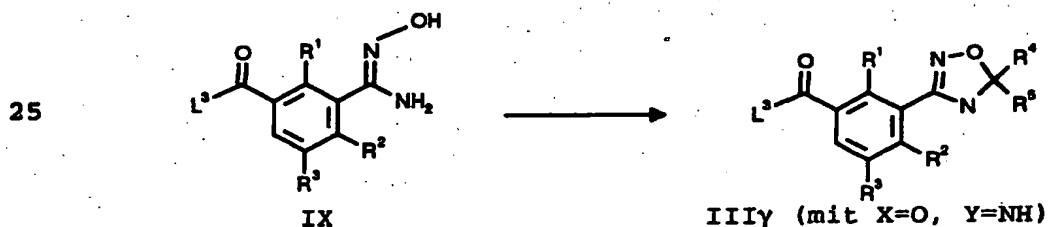


- 10 (mit $L^4 = \text{Br, J, OSO}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) (mit $M = \text{Sn}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl})_3, \text{B}(\text{OH})_2, \text{ZnHal}$, wobei Hal für Cl oder Br steht)

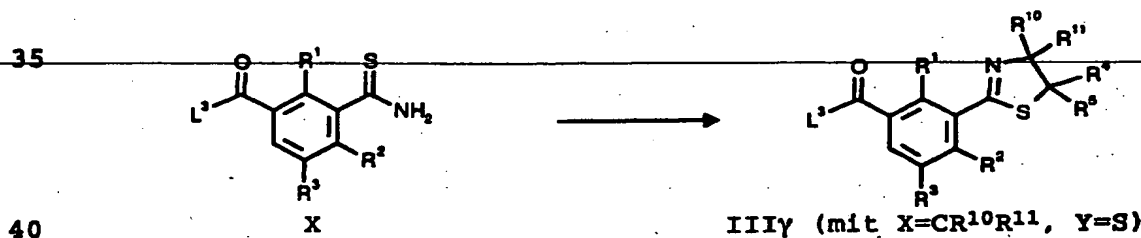
- 15 Ebenso ist es möglich, Ester der Formel IIIy durch Aufbau des in 3-Position gebundenen Heterocycluses zu erhalten.

Beispielsweise können aus Amidoximen der Formel IX durch Kondensation mit Aldehyden oder Ketonen 1,2,4-Oxadiazolin-3-yl-Derivate

- 20 (IIIy mit $X=\text{O}, Y=\text{NH}$) hergestellt werden (vgl. z.B. Arch. Phar. 326, 383-389 (1993)).



- 30 Die Thioamide der Formel X sind geeignete Vorprodukte für 2-Thiazolinyl-Derivate I (mit $X=\text{CR}^{10}\text{R}^{11}, Y=\text{S}$) (vgl. z.B. Tetrahedron 42, 1449-1460 (1986)).

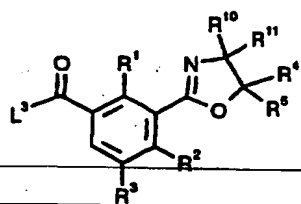


- Aus den Carbonsäuren der Formel XI sind 2-Oxazolinyl-, 2-Thiazolinyl- und 2-Imidazolinyl-Derivate (IIIy mit $X=\text{CR}^{10}\text{R}^{11}, Y=\text{O}$ bzw. $Y=\text{S}$ bzw. $Y=\text{NH}$) zugänglich (vgl. z.B. Tetrahedron Let. 22, 45 4471-4474 (1981)).

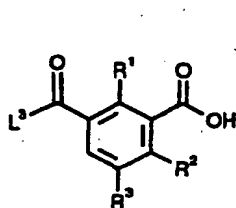
N 000190

109

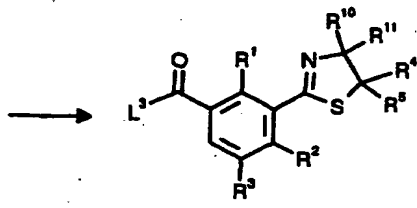
5

IIIy
(mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=O$)

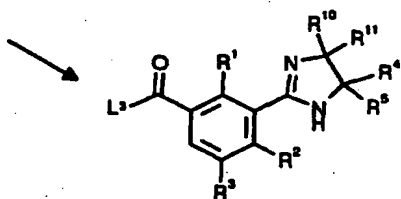
10



XI

IIIy
(mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=S$)

15

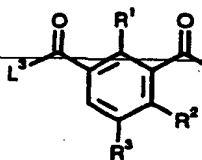
IIIy
(mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=NH$)

20

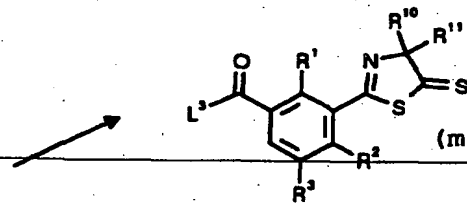
Nach literaturbekannten Verfahren können aus Carbonsäurehalogeniden der Formel XII, wobei Hal für Halogen steht, insbesondere aus Carbonsäurechloriden, 1,3-Thiazol-5(4H)-thion-2-yl- (vgl. z.B. Helv. Chim. Acta, 69, 374-388 (1986)) und 5-Oxo-2-imidazolin-2-yl-Derivate (vgl. z.B. Heterocycles 29, 1185-1189 (1989)) (III mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=S$ bzw. $Y=NH$) hergestellt werden.

30

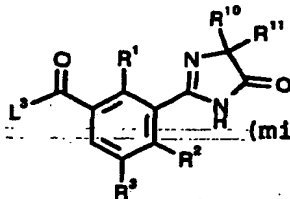
35



XII

IIIy
(mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=S$)

40

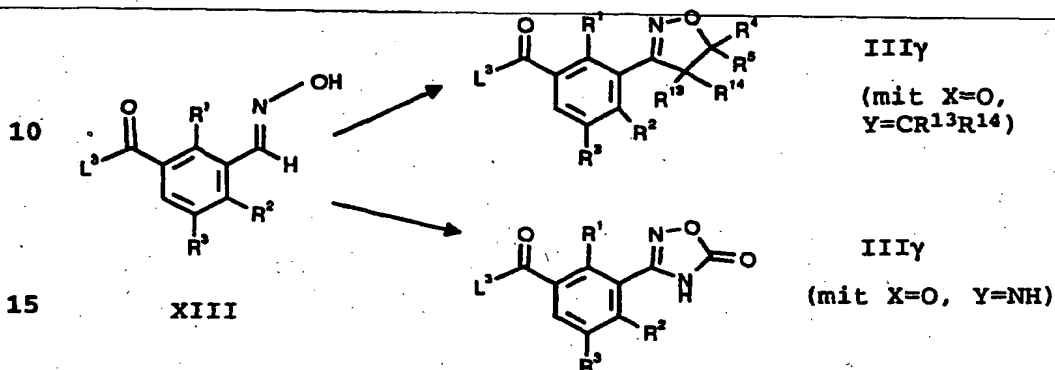
IIIy
(mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=NH$)

Die Umwandlung von Oximen der Formel XIII in 4,5-Dihydro-isoxazol-3-yl-Derivate (mit IIIy mit $X=O$, $Y=CR^{13}R^{14}$) kann in an sich bekannter Weise über die Zwischenstufe der Hydroxamsäurechloride XIV erfolgen. Aus letzteren werden in situ Nitriloxide erzeugt,

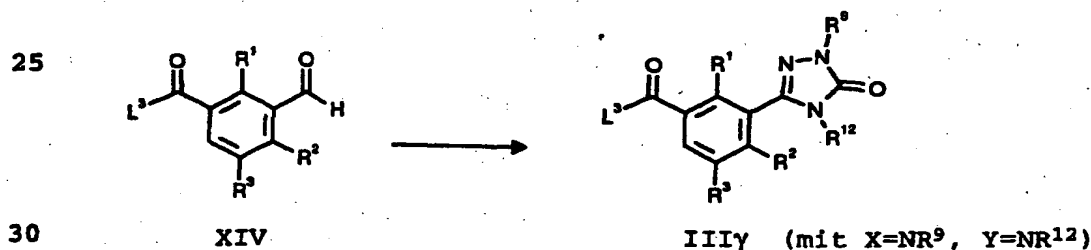
M 08.01.93

110

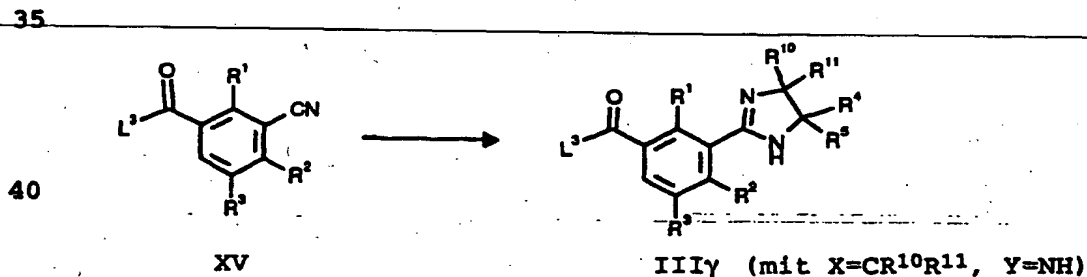
die mit Alkenen zu den gewünschten Produkten abreagieren (vgl. z.B. Chem. Ber. 106, 3258-3274 (1973)). 1,3-Dipolare Cycloadditionen von Chlorsulfonylisocyanat an Nitriloxide liefern 1,2,4-Oxadiazolin-5-on-3-yl-Derivate (IIIy mit X=O, Y=NH) (vgl. 5 z.B. Heterocycles 27, 683-685 (1988)).



Die Aldehyde der Formel XIV können über die Zwischenstufe der Se-
20 micarbazone in 2,4-Dihydro-1,2,4-triazol-3-on-5-yl-Derivate (IIIy mit X=NR⁹, Y=NR¹²) umgewandelt werden (vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 23, 881- 883 (1986)).



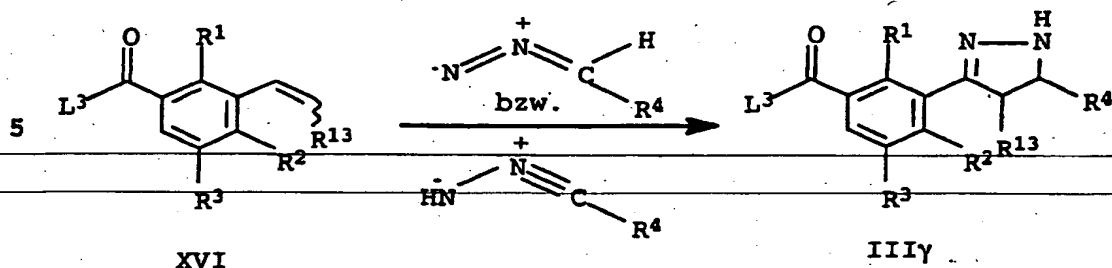
2-Imidazoliny-Derivate (IIIy mit X=CR¹⁰R¹¹, Y=NH) sind auch aus Benzonitrilen der Formel XV nach bekannten Methoden (vgl. z.B. J. Org. Chem. 52, 1017-1021 (1987)) herzustellen.



Mittels 1,3-dipolarer Cycloaddition von Diazoalkanen bzw. Nitril-
45 iminen mit Arylalkenen der Formel XVI können 3-Pyrazoliny-Derivate (IIIy mit X=NH, Y=CHR¹³) dargestellt werden.

N 08.01.98

111



10

(mit X=NH, Y=CHR¹³)

Die als Ausgangsverbindungen verwendeten Brom- oder Iod-substituierten Verbindungen der Formel V können in Analogie zu literaturbekannten Methode, z.B. durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden, die ihrerseits durch Reduktion geeigneter Nitroverbindungen synthetisiert werden. Die Brom-substituierten Verbindungen der Formel V können außerdem durch direkte Bromierung geeigneter Edukte erhalten werden (vgl. Monatsh. Chem. 99, 815-822 (1968)).

20

Die Nitrile der Formel VI können wie oben beschrieben erhalten werden. Ebenso ist es möglich, diese aus entsprechenden Anilinen mittels Sandmeyer-Reaktion darzustellen.

25 Die Ausgangsverbindungen der Formel VII sind bekannt (vgl. z.B. Coll. Czech. Chem. Commun. 40, 3009-3019 (1975)) oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

30 Beispielsweise können die Sulfonate XII ($L^4 = \text{OSO}_2\text{CF}_3$, OSO_2F) aus den entsprechenden Phenolen, die ihrerseits bekannt sind (vgl. z.B. EP-A 195 247) oder nach bekannten Methoden hergestellt werden können, erhalten werden (vgl. z.B. Synthesis 1993, 735-762).

35 Die Halogenverbindungen VII ($L^4 = \text{Cl}$, Br oder I) können beispielsweise durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen der Formel XIX erhalten werden.

Die Amidoxime der Formel IX, die Thioamide der Formel X und die Carbonsäuren der Formel XI können auf an sich bekannte Art und Weise aus den Nitrilen der Formel XV dargestellt werden.

Weiterhin ist es möglich, die Carbonsäuren der Formel XI aus den Aldehyden der Formel XIV nach bekannten Verfahren herzustellen (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Auflage, S. 629 ff, Wiley-Interscience Publication (1985)).

45

H 000198

112

Die Carbonsäurehalogenide der Formel XII können in Analogie zu Standardverfahren aus den entsprechenden Carbonsäuren der Formel XI erhalten werden.

5 Die Oxime der Formel XIII erhält man vorteilhaft dadurch, daß man in an sich bekannter Weise Aldehyde der Formel XIV mit Hydroxylamin umsetzt (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)).

10 Die Aldehyde der Formel XIV sind bekannt oder in Analogie zu bekannten Verfahren darstellbar. So können sie aus Methylverbindungen der Formel XVII durch Bromierung, beispielsweise mit N-Bromsuccinimid oder 1,3-Dibrom-5,5-dimethylhydantoin, und anschließende Oxidation dargestellt werden (vgl. Synth. Commun. 15 22, 1967 - 1971 (1992)).

Die Umwandlung der Oxime der Formel XIII in Nitrile der Formel XV kann ebenfalls nach an sich bekannten Verfahren erfolgen (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Aufl., S. 931-932, 20 Wiley-Interscience Publication (1985)).

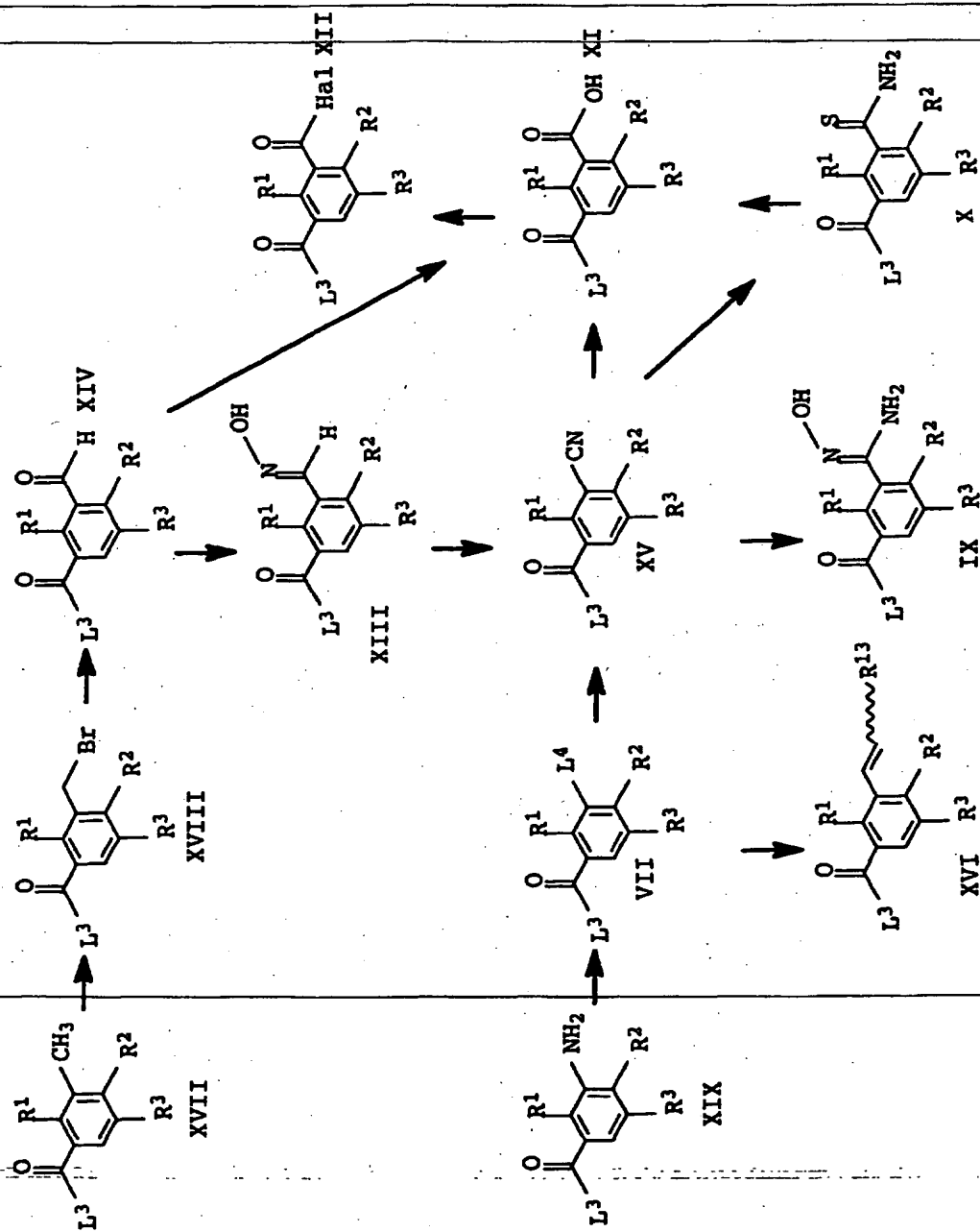
Ausgehend von den Halogenverbindungen oder Sulfonaten der Formel VII ($L^4 = \text{Br}, \text{Cl}, \text{OSO}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) lassen sich u.a. durch Heck-Reaktion mit Olefinen in Gegenwart eines Palladiumkatalysators 25 Arylalkene der Formel XVI darstellen (vgl. z.B. Heck, Palladium Reagents in Organic Synthesis, Academic Press, London 1985; Synthesis 1993, 735 - 762).

30

35

40

45



M 05.01.98

114

Herstellungsbeispiele:

4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-5-hydroxy-1-methyl-1H-pyrazol (Verbindung 3.35)

- Zu einer Lösung von 12,74 g (0,13 mol) 5-Hydroxy-1-methyl-pyrazol und 300 ml wasserfreiem Dioxan wurden unter Schutzgasatmosphäre bei Raumtemperatur gleichzeitig 43,60 g (0,13 mol) 10 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl-chlorid in 375 ml wasserfreiem Dioxan und 13,56 g (0,134 mol) Triethylamin in 375 ml wasserfreiem Dioxan getropft. Nach 2 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Reaktionsgemisch über Kieselgel abfiltriert und mit Dioxan nachgewaschen. Das Eluat 15 wurde am Vakuum auf ca. 500 ml eingengt und mit 17,94 g (0,13 mol) getrocknetem, fein gepulvertem Kaliumcarbonat versetzt. Nach 6 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wurde das Lösungsmittel am Vakuum abdestilliert und der Rückstand in ca. 700 ml Wasser aufgenommen. Unlösliche Bestandteile wurden abfiltriert und der pH-Wert des 20 Filtrats durch langsame Zugabe von 10 %iger Salzsäure auf pH = 2 - 3 eingestellt. Der sich bildende Niederschlag wurde abgesaugt. Man erhielt 46,16 g (92 % d. Th.) 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-5-hydroxy-1-methyl-1H-pyrazol. 25 (Fp. > 250°C)

- In Tabelle 3 sind neben der voranstehenden Verbindung noch weitere 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder 30 herstellbar sind (falls die Endprodukte beim Ansäuern mit 10 %iger Salzsäure nicht ausgefallen sind, wurden sie mit Essigsäureethylester oder Dichlormethan extrahiert; anschließend wurde die organische Phase getrocknet und am Vakuum eingengt):

35

40

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

R 0001 98

115

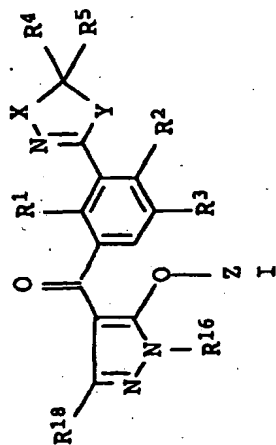


Tabelle 3:

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|-----|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.1 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | H | H | 115 - 117 |
| 3.2 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | 1-C ₄ H ₉ | H | H | 148 - 151 |
| 3.3 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 0,95(t); 1,32(m); 1,62(t); 1,92(quin); 3,30(t); 3,78(quin); 4,17(t); 4,61(t); 7,42(d); 7,48(m). |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

116

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Ep. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|----------------------------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.4 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 0,96(d); 1,21(d); 2,33(m); 2,48(m); 3,30(t); 3,67(d); 3,97(d); 4,58(t); 7,42(d); 7,50(m). |
| 3.5 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 0,97(t); 1,20(d); 1,96(m); 2,49(m); 3,30(t); 3,68(d); 4,12(t); 4,59(t); 7,42(d); 7,49(d); 7,52(s). |
| 3.6 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 0,97(t); 1,12(d); 1,63(t); 1,94(m); 3,29(t); 3,76(q); 4,14(t); 4,60(t); 7,42(d); 7,48(d); 7,51(s). |
| 3.7 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 70 - 75 |
| 3.8 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 65 - 70 |
| 3.9 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 230 - 235 |
| 3.10 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 210 - 215 |
| 3.11 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 95 - 100 |
| 3.12 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 70 - 75 |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

117

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|-------------------------------|-----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|--|
| 3.13 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 78 - 83 |
| 3.14 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 1,24 (2d); 1,53 (t); 2,52 (m); 3,05 (dd); 3,29 (s); 3,52 (dd); 3,73 (d); 4,24 (q); 5,05 (m); 7,49 (s); 7,66 (d); 8,18 (d). |
| 3.15 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 0,96 (t); 1,53 (d); 1,68 (t); 1,95 (sext); 3,07 (dd); 3,32 (s); 3,58 (dd); 3,86 (quart); 4,15 (t); 5,03 (m); 7,46 (d); 7,64 (d); 8,18 (d). |
| 3.16 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 220 - 225 |
| 3.17 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 82 - 86 |
| 3.18 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 70 - 75 |
| 3.19 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | H | H | 68 - 73 |
| 3.20 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | H | H | 45 - 50 |
| 3.21 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 220 - 225 |
| 3.22 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 170 - 175 |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

118

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.23 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 65 - 70 |
| 3.24 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | H | H | 55 - 60 |
| 3.25 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | H | H | 58 - 63 |
| 3.26 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 78 - 83 |
| 3.27 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 0,94 (t); 1,19 (d); 1,22 (t); 1,38 (m); 1,74 (br); 1,91 (m); 2,53 (m); 3,26 (s); 4,45 (t); 3,76 (d); 4,18 (t); 4,62 (t); 7,45 (s); 7,64 (d); 8,16 (d). |
| 3.28 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 0,96 (d); 1,21 (d); 2,33 (m); 2,51 (m); 3,28 (s); 3,44 (t); 3,75 (d); 3,99 (d); 4,61 (t); 7,45 (s); 7,66 (d); 8,17 (d). |
| 3.29 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 0,97 (d); 1,66 (t); 2,36 (m); 3,29 (s); 3,43 (t); 3,82 (q); 3,99 (d); 4,60 (t); 7,47 (s); 7,68 (d); 8,18 (d). |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z.: 0050/47679:

119

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---|----------------|---|-----------------|-----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.30 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 1,68(t); 3,29(s); 3,43(t); 3,78(q); 3,92(s); 3,63(t); 7,46(s); 7,62(d); 8,17(d); |
| 3.31 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | 1-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 1,23(d); 2,53(m); 3,28(s); 3,43(t); 3,70(d); 3,91(s); 4,61(t); 7,48(s); 7,66(d); 8,18(d); |
| 3.32 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 119 - 121 |
| 3.33 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | CH ₃ | 115 - 117 |
| 3.34 | Cl | NO ₂ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 217 - 218 |
| 3.35 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | > 250 |
| 3.36 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 125 - 128 |
| 3.37 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | n-C ₃ H ₇ SO ₂ | H | 78 - 83 |
| 3.38 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 1,52(t); 1,68(t); 3,29(s); 3,43(t); 3,82(q); 4,24(q); 4,63(t); 7,48(s); 7,65(d); 8,07(d); |
| 3.39 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | > 200 |
| 3.40 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 220 - 223 |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

120

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------------|----------------|--|----------------|----------------------------------|-----------------|----------------|-----------------|-------------------------------|------------------------------|-----------------|---|
| 3.41 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | > 230 |
| 3.42 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 1,12(t); 1,53(d); 1,76(quin); 3,18(dd); 3,38(t); 3,55(dd); 3,73(s); 5,04(m); 5,55(s, br.); 7,37(s); 7,68(d); 8,13(d) |
| 3.43 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 1,07(t); 1,50(m); 1,78(quin); 3,07(dd); 3,39(t); 3,55(dd); 4,12(t); 5,08(m); 7,38(s); 7,69(d); 8,11(d) |
| 3.44 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | CH ₃ | H | H | |
| 3.45 a) | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | CH ₃ | H | H | 1,33(s); 3,40(s); 4,17(s); 7,43(s); 7,79(d); 8,04(d) |
| 3.46 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | Na ⁺ | H | 218 - 220 |
| 3.47 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | K ⁺ | H | 193 |
| 3.48 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | Li ⁺ | H | > 230 |
| 3.49 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | NH ₄ ⁺ | H | 170 - 175 |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

121

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Pp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------------|----------------|--|----------------|----------------------------------|---|--------------------------------------|-----------------|-------------------------------|------------------------------|-----------------|--|
| 3.50 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | Na ⁺ | H | > 240 |
| 3.51 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | K ⁺ | H | 206 - 214 |
| 3.52 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | Li ⁺ | H | > 240 |
| 3.53 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | NH ₄ ⁺ | H | |
| 3.54 a) | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | C ₂ H ₅ | H | H | 1,27(t); 1,36(s); 3,41(q); 4,01(q); 4,18(s); 7,47(s); 7,83(d); 8,07(d). |
| 3.55 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ CH- | | C ₂ H ₅ | H | H | 99-104 |
| 3.56 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ CH- | | CH ₃ | H | H | 95-100 |
| 3.57 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | CH ₂ | | CH ₃ | H | H | 230-235 |
| 3.58 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | CH ₂ | | C ₂ H ₅ | H | H | 190-195 |
| 3.59 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ | CH ₂ | | C ₂ H ₅ | H | H | 95-100 |
| 3.60 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | < 230 |
| 3.61 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 198-200 |
| 3.62 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 215-218 |
| 3.63 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 213-215 |
| 3.64 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 186-190 |
| 3.65 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 84-86 |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z.: Q050/47679

M 05.01.98

122

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|---|-------------------------------|-----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|
| 3.66 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 90-95 |
| 3.67 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 70-75 |
| 3.68 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 50-55 |
| 3.69 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | H | 148-153 |
| 3.70 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | H | 1,25 (t); 1,32 (t); 1,74 (m); 2,02 (m); 3,05 (s); 3,37 (s); 4,04 (q); 4,39 (q); 7,54 (s); 7,86 (d); 8,09 (d). |

a) Hergestellt aus 3-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid mit zwei Äquivalenten Kaliumcarbonat

M 08.01.98

Nachfolgend sind die Synthesen einiger Ausgangsstoffe aufgeführt:

2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl-
5 chlorid (Verbindung 4.5)

Stufe a) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon

10 Zu einer Suspension von 286 g (2,14 mol) Aluminiumtri-
chlorid in 420 ml 1,2-Dichlorethan wurde bei 15-20°C
eine Lösung von 157 g (2 mol) Acetylchlorid in 420 ml
1,2-Dichlorethan getropft. Anschließend wurde eine Lösung
15 von 346 g (2 mol) 2-Chlor-6-methylthio-toluol in 1 l
1,2-Dichlorethan zugetropft. Nach 12 Stunden Rühren wurde
das Reaktionsgemisch in eine Mischung aus 3 l Eis und 1 l
konz. HCl gegossen. Es wurde mit Methylenchlorid extra-
20 hiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit
Natriumsulfat getrocknet und eingengt. Der Rückstand
wurde im Vakuum destilliert. Man erhielt 256 g (60 %
d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-thio-acetophenon.
(Fp.: 46°C)

Stufe b) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon

25 163,0 g (0,76 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-aceto-
phenon wurden in 1,5 l Eisessig gelöst, mit 18,6 g
Natriumwolframat versetzt und unter Kühlung 173,3 g
30 %ige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Es wurde
2 Tage nachgerührt und anschließend mit Wasser verdünnt.
30 Der ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, mit Wasser
gewaschen und getrocknet. Man erhielt 164,0 g (88 %
d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon.
(Fp.: 110-111°C)

35 Stufe c) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure

40 82 g (0,33 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-aceto-
phenon wurden in 700 ml Dioxan gelöst und bei Raum-
temperatur mit 1 l einer 12,5 %igen Natriumhypochlorit-
lösung versetzt. Anschließend wurde 1 Stunde bei 80°C
nachgerührt. Nach dem Abkühlen bildeten sich zwei Phasen,
von denen die untere mit Wasser verdünnt und schwach
angesäuert wurde. Der ausgefallene Feststoff wurde abge-
45 saugt, mit Wasser nachgewaschen und getrocknet. Man er-
hielt 60 g (73 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfo-
nyl-benzoesäure.
(Fp.: 230-231°C)

M 08.01.98

124

Stufe d) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

5

100 g (0,4 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure wurden in 1 l Methanol gelöst und bei Rückflußtemperatur 5 Stunden mit Chlorwasserstoff begast.

Anschließend wurde eingeeengt. Man erhielt 88,5 g (84 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

(Fp.: 107-108°C)

10

Stufe e) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

15

82 g (0,31 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester werden in 2 l Tetrachlormethan gelöst und unter Belichtung portionsweise mit 56 g (0,31 mol) N-Bromsuccinimid versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert, das Filtrat eingeeengt und der Rückstand in 200 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die Lösung wurde mit Petrolether versetzt, der ausgefallene Feststoff abgesaugt und getrocknet. Man erhielt 74,5 g (70 % d.Th.) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

(Fp.: 74-75°C)

25

Stufe f) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

30

Eine Lösung von 41,0 g (0,12 mol) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 250 ml Acetonitril wurde mit 42,1 g (0,36 mol) N-Methylmorpholin-N-oxid versetzt. Der Ansatz wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, anschließend eingeeengt und der Rückstand in Essigsäureethylester aufgenommen. Die Lösung wurde mit Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 31,2 g (94 % d.Th.)

35

2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Fp.: 98-105°C)

Stufe g) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure

40

15,00 g (54 mmol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 4,20 g (60 mmol) Hydroxylaminhydrochlorid wurden in 300 ml Methanol aufgenommen und eine Lösung von 3,18 g (30 mmol) Natriumcarbonat in 80 ml Wasser zugetropft. Nach 12 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Methanol abdestilliert, der Rückstand mit Wasser verdünnt und mit Diethylether extrahiert. Nach

45

M 00.01.90

125

Trocknen der organischen Phase wurde das Lösungsmittel entfernt. Man erhielt 14,40 g (91 % d.Th.)

2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

(Fp.: 126-128°C).

5

Stufe h) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.3)

10

In eine Lösung von 158,0 g (0,54 mol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 1 l Dichlormethan wurde bei 15-20°C 30 Minuten lang Ethylen eingeleitet. Nach Zugabe von 1,6 g Natriumacetat wurden 454 ml Natriumhydrochlorit-Lösung bei 10°C unter gleichzeitiger Ethylen-Einleitung zugetropft. Anschließend wurde für weitere 15 Minuten Ethylen bei 10°C eingeleitet. Nach 12 Stunden Rühren wurden die Phasen getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 156,5 g (90 % d.Th.) 2-Chlor-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

15

20

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,24 (s); 3,42 (t); 3,99 (s); 4,60 (t); 7,96 (d); 8,10 (d)).

25 Stufe i) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.4)

30

Zu einem Gemisch von 170,0 g (0,54 mol) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 1 l Methanol wurde bei 40-45°C langsam eine Lösung von 32,8 g Natriumhydroxid gelöst in 330 ml Methanol getropft. Die Suspension wurde 5 Stunden bei 50°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels nahm man den Rückstand in 1,5 l Wasser auf und extrahierte die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester. Die

35

wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden anschließend mit Wasser neutral gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 148,8 g (91 % d.Th.) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure.

40

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,26 (s); 3,45 (t); 4,63 (t); 8,15 (s); 8,53 (s, br)).

45

H 08.01.98

126

Stufe j) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.5)

5

Zu einer Lösung von 139,0 g 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 1 l trockenem Toluol wurden bei 50°C 74,8 g

10

(0,63 mol) Thionylchlorid in 50 ml trockenem Toluol getropft. Nach 6 Stunden Erhitzen auf 110°C wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Man erhielt 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid in quantitativer Ausbeute.

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,25 (s); 3,46 (t); 4,62 (t); 8,21 (dd)).

15 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.39)

Stufe a) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.25)

20

In eine Lösung von 15,0 g (52 mmol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 200 ml Dichlormethan wurde bei Raumtemperatur 30 Minuten lang Propen eingeleitet. Nach Zugabe von 1,6 g Natriumacetat wurden 42,8 ml Natriumhydrochlorit-Lösung bei Raumtemperatur unter gleichzeitiger Propen-Einleitung zugetropft. Anschließend wurde für weitere 15 Minuten Propen bei Raumtemperatur eingeleitet. Nach 3 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, nochmals 5 Stunden unter Rückfluß Propen eingeleitet und wiederum 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach Trennung der Phasen wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 15,5 g (89 % d.Th.) 2-Chlor-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

25

30

35

(Fp.: 130-135°C).

40 Stufe b) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.26)

45

Zu einem Gemisch von 15,00 g (45 mmol) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 200 ml Methanol wurde langsam eine Lösung von 3,52 g (88 mmol) Natriumhydroxid gelöst in 100 ml Methanol getropft. Die Suspension wurde 48 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach Abdestillieren des

H 080199

127

5 Lösungsmittels nahm man den Rückstand in Wasser auf und wusch die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester. Die wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden anschließend mit Wasser neutral gewaschen, getrocknet und eingeeignet. Man erhielt 13,20 g (92 % d.Th.) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure. (Fp.: 173-178°C).

10

Stufe c) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.39)

15

Zu einer Lösung von 13,0 g (41 mmol) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 250 ml trockenem Toluol wurden bei Raumtemperatur 5,7 g (51 mmol Thionylchlorid getropft. Anschließend wurde bis zur vollständigen Umsetzung unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Man erhielt 14,2 g 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylbenzoylchlorid in quantitativer Ausbeute.

20

2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid

25

Stufe a) 2-Chlor-3-hydroxycarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

30

Zu einer Lösung von 115,3 g (0,42 mol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 2000 ml Acetonitril wurden bei 5°C nacheinander 13,8 g (0,11 mol) Natriumhydrogenphosphatmonohydrat in 170 ml Wasser, 49,3 g (0,43 mol) 30 %ige Wasserstoffperoxidlösung und 66,2 g (0,59 mol) 80 %ige wäßrige Natrium-

35

chloritlösung gegeben. Die Reaktionslösung wurde anschließend 1 Stunde bei 5°C und 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde mit 10 %iger Salzsäure auf pH = 1 eingestellt und 1500 ml wäßrige 40 %ige Natriumhydrogensulfit-Lösung zugegeben. Nach 1 Stunde Rühren bei Raumtemperatur wurde die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Natriumhydrogensulfit-Lösung gewaschen und getrocknet. Nach Abdestillation des Lösungsmittels erhielt man 102,0 g 2-Chlor-3-hydroxycarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

40

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

H 000190

128

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,34 (s); 3,93 (s); 8,08 (s); 14,50 (s, br.).)

Stufe b) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure-methylester

5

10

Zu einer Lösung von 6,0 g (0,021 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-carbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 50 ml trockenem Toluol wurden 2 Tropfen Dimethylformamid und 11,9 g (0,1 mol) Thionylchlorid gegeben. Die Lösung wurde 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Entfernen des Lösungsmittels am Vakuum erhielt man 6,2 g 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

15

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,21 (s); 4,02 (s); 8,02 (d); 8,07 (d).)

Stufe c) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

20

Zu einer Lösung von 4,54 g (50 mmol) 2,2-Dimethylethanolamin in 40 ml Dichlormethan wurde bei 0-5°C eine Lösung von 7,80 g (25 mmol) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester getropft. Nach 6 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde die Reaktionslösung dreimal mit Wasser extrahiert, getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 8,20 g (80 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

25

(Fp.: 70-72°C).

30

Stufe d) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

35

Ein Gemisch aus 6,9 g (20 mmol) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 5 ml Thionylchlorid wurde 6 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Lösung wurde mit 50 ml Dichlormethan verdünnt und anschließend eingeeengt. Der Rückstand wurde in 20 ml Dichlormethan gelöst. Durch Zugabe von Cyclohexan bildete sich ein kristalliner Niederschlag, der abgesaugt und getrocknet wurde. Man erhielt 6,4 g (88 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

40

45

11 03.01.98

129

Stufe e) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.38)

5

Eine Lösung von 5,82 g (15 mmol) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 0,81 g (20 mmol) Natriumhydroxid in 80 ml Methanol rührte 8 Stunden bei Raumtemperatur. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurde der Rückstand in Wasser aufgenommen und dreimal mit Essigsäureethylester gewaschen. Die wäßrige Phase wird mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Nach dem Trocknen der organischen Phase entfernte man das Lösungsmittel am Vakuum. Man erhielt 3,10 g (56 % d.Th.) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure. (¹H-NMR (δ in ppm): 1,34 (s); 3,40 (s); 4,13 (s); 8,07 (s); 13,95 (s, br)).

10

15

20

Stufe f) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid

25

Eine Lösung von 3,00 g (9 mmol) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure, 1,43 g Thionylchlorid und 1 Tropfen Dimethylformamid in 80 ml trockenem Toluol wurde 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde das Lösungsmittel am Vakuum abdestilliert. Man erhielt 3,43 g (86 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid.

30

2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.22)

35

Stufe a) 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

40

In eine Lösung von 15,0 g (48 mmol) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 300 ml trockenem Dioxan wurde 2 Stunden lang Ammoniak geleitet. Der gebildete Niederschlag wurde abgesaugt und das Filtrat eingeeengt. Man erhielt 15,2 g 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in quantitativer Ausbeute.

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 00.01.98

130

Stufe b) 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

5

Zu einer Lösung von 4,37 g (15 mmol) 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 150 ml trockenem Toluol wurden 9,80 g (75 mmol) Chlorcarbonyl-

10

sulfonylchlorid getropft. Nach 48 Stunden Rühren unter Rückfluß wird das Lösungsmittel am Vakuum entfernt und der Rückstand am Kieselgel chromatographiert (Eluent: Essigsäureethylester/Cyclohexan = 1/1). Man erhielt 3,70 g (70 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

15 In der nachfolgenden Tabelle 4 sind neben den voranstehend beschriebenen Verbindungen weitere Benzoessäurederivate der Formel III aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder herstellbar sind.

20

25

30

35

40

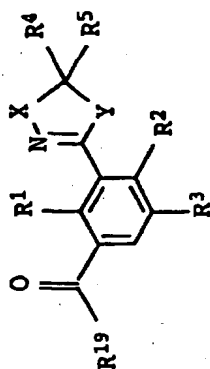
45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O. Z. 0050/47679

131



III

Tabelle 4:

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|-----|----------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------|-----------------|------------------|---|
| 4.1 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 3,29 (t); 3,91 (s); 4,58 (t); 7,46 (d); 7,83 (d). |
| 4.2 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,28 (t); 4,60 (t); 7,02 (s, br); 7,46 (d); 7,98 (d). |
| 4.3 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 3,24 (s); 3,42 (t); 3,99 (s); 4,60 (t); 7,96 (d); 8,10 (d). |
| 4.4 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,26 (s); 3,45 (t); 4,63 (t); 8,15 (s); 8,53 (s, br). |
| 4.5 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | Cl | 3,25 (s); 3,46 (t); 4,62 (t); 8,21 (dd). |
| 4.6 | Cl | Cl | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | OH | 1,31 (s); 4,16 (s); 7,69 (d); 7,90 (d); 13,8 (s, br). |

BASF Aktiengesellschaft

960970:

O. B. 0050/47679

132

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|--|----------------|-----------------|-----------------|-----------------|-----------------|------------------|---|
| 4.7 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 1,25 (t); 1,57 (s); 3,21 (s); 3,42 (q); 3,99 (s); 7,94 (d); 8,07 (d). |
| 4.8 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OH | 1,13 (t); 1,47 (s); 3,15 (s); 3,43 (q); 8,06 (s); 13,8 (s, br). |
| 4.9 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,28 (t); 3,41 (m); 4,02 (s); 4,62 (t); 7,95 (d); 8,06 (d). |
| 4.10 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 137-140 |
| 4.11 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,26 (t); 1,53 (d); 3,06 (dd); 3,42 (q); 3,49 (dd); 5,05 (m); 7,95 (d); 8,07 (d). |
| 4.12 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OH | 140-143 |
| 4.13 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | OCH ₃ | 3,30 (s); 3,98 (s); 4,11 (t); 4,55 (t); 7,97 (d); 8,08 (d). |
| 4.14 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | OH | 3,38 (s); 4,00 (t); 4,46 (t); 8,08 (s). |
| 4.15 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,30 (s); 3,35 (t); 4,15 (s, br); 4,50 (t); 8,05 (s). |
| 4.16 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 0,95 (t); 1,47 (s); 1,58 (quin); 3,12 (s); 3,31 (s); 3,43 (t); 3,93 (s); 8,09 (dd). |
| 4.17 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OH | 0,93 (t); 1,47 (s); 1,58 (quin); 3,15 (s); 3,42 (t); 8,05 (s). |

BASF Aktiengesellschaft

960970:

O.E. 9050/47679

133.

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|--|----------------|---|----------------------------------|-----------------|-----------------|------------------|--|
| 4.18 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 0,92 (t); 1,55 (quin); 3,39 (m); 3,93 (s); 4,50 (t); 8,08 (dd). |
| 4.19 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 148-150 |
| 4.20 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 0,93 (t); 1,49 (d); 1,58 (quin); 2,94 (dd); 3,42 (m); 3,93 (s); 4,97 (m); 8,10 (dd). |
| 4.21 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OH | 0,94 (t); 1,39 (d); 1,58 (quin); 2,96 (dd); 3,50 (m); 4,95 (m); 8,05 (s). |
| 4.22 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | S | =O | | O | OCH ₃ | 3,24 (s); 4,02 (s); 8,14 (dd). |
| 4.23 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 118-121 |
| 4.24 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OH | |
| 4.25 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 130-135 |
| 4.26 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OH | 173-178 |
| 4.27 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 1,57 (s); 3,18 (s); 3,27 (s); 4,01 (s); 7,97 (d); 8,12 (d). |
| 4.28 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OH | 1,48 (s); 3,15 (s); 3,34 (s); 8,08 (dd). |
| 4.29 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 0,97 (t); 1,72 (m); 3,10 (dd); 3,32 (s); 3,37 (dd); 4,72 (m); 8,08 (dd). |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O, Z 0050/47679

134

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|---|---------------------------------------|-----------------|------------------|--|
| 4.30 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | | OCH ₃ | 1,57 (m); 1,81 (m); 2,21 (m); 3,20 (s); 4,02 (s); 4,32 (t); 5,35 (dd); 7,92 (d); 8,18 (d). |
| 4.31 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | | OH | 1,72 (m); 2,01 (m); 3,27 (s); 4,24 (t); 5,23 (dd); 8,05 (d); 8,15 (d); 13,8 (s, br). |
| 4.32 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | OCH ₃ | 2,00 (m); 3,23 (s); 3,27 (s); 3,72 (m); 4,00 (s); 7,96 (d); 8,04 (d). |
| 4.33 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | OH | 78-83 |
| 4.34 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | OCH ₃ | 1,78 (m); 2,24 (m); 3,27 (s); 3,36 (s); 3,98 (s); 7,94 (d); 8,12 (d). |
| 4.35 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | OH | 1,76 (m); 2,05 (m); 3,30 (s); 3,33 (s); 8,09 (dd). |
| 4.36 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | OCH ₃ | 1,00 (t); 1,85 (m); 3,13 (s); 3,27 (s); 3,98 (s); 7,94 (d); 8,11 (d). |
| 4.37 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | OH | 0,91 (t); 1,76 (m); 3,12 (s); 3,33 (s); 8,07 (dd); 13,75 (s, br). |
| 4.38 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | OH | 1,34 (s); 3,40 (s); 4,13 (s); 8,07 (s); 13,95 (s, br). |
| 4.39 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | Cl | |

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

135

N 08.01.98

Die 3-Heterocycly-substituierten Benzoylderivate der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als 5 Herbizide. Die Verbindungen der Formel I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schädgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser 10 Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung 15 unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris 20 spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis 25 guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot 30 esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum 35 tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kul- 40 turen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt 45 versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln,

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 08.01.98

136

Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der 5 erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel. 10

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen 15 oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser. 20

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur 25 Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell 30 Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. 35 Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner 40 Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyletheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen- 45 oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoetheracetat,

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

137

H 08.01.98

Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder
5 gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen
Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate
können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe her-
10 gestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kiesel-
säuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk,
Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und
Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Dünge-
mittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat,
15 Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baum-
rinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere
feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den
20 anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen va-
riiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa
von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindes-
tens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Rein-
heit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spek-
25 trum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstel-
lung solcher Zubereitungen:

30 I. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 3.2 werden in einer
Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem
Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8
bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid,
5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure
35 und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol
Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und
feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser
erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des
Wirkstoffs enthält.

40

II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 3.9 werden in einer
Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon,
30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlage-
rungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctyl-
phenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von
40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ein-
45 gießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichts-

11 08.01.98

teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- III. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.10 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.16 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.21 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.22 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- VII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 3.34 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- VIII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 3.35 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol®-EM-31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

11 08.01.98

Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so ges-

~~spritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).~~

10

Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

15

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt

20 und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta- CF_3 -Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexanonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole,

30 Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und

35 deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonilharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.

40 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner

45 die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von

N 08.01.98

Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Anwendungsbeispiele

5

~~Die herbizide Wirkung der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoyl-~~
~~derivate der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshaus-~~
~~versuche zeigen:~~

- 10 Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

- Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder
15 emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Test-
20 pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

- Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm
25 angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.
30 Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 31,2 bzw. 15,6 g/ha a.S. (aktive Substanz).

- Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte
35 sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

- Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100
40 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

- Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich
45 aus folgenden Arten zusammen:

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 08.01.98

141

| Lateinischer Name | Deutscher Name | Englischer Name |
|-------------------|-------------------------|------------------------------|
| Chenopodium album | Weißer Gänsefuß | lambsquartars (goosefoot) |
| Setaria faberii | Borstenhirse | giant foxtail |
| Sinapsis alba | weißer Senf | white mustard |
| Solanum nigrum | Schwarzer Nachtschatten | black nightshade |
| Triticum aestivum | Winterweizen | winter wheat |
| Zea mays | Mais | Indian corn |

Bei Aufwandmengen von 31,2 bzw. 15,6 g/ha zeigte die Verbindung 3.33 (Tabelle 3) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die oben genannten mono- und dicotylen Schadpflanzen und gute Verträglichkeit in Winterweizen und Mais.

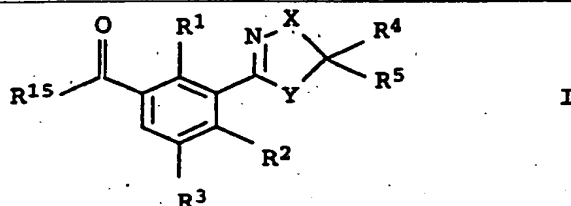
H 08.01.98

Patentansprüche

1. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

5

10



15

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

20

R^1, R^2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl;

25

R^3 Wasserstoff, Halogen oder C_1 - C_6 -Alkyl;

30

R^4, R^5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Di-(C_1 - C_4 -alkoxy)- C_1 - C_4 -alkyl, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-amino- C_1 - C_4 -alkyl, [2,2-Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-hydrazino-1]- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkyliminoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Cyanoalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-amino, COR^6 , Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten

35

partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

40

Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy;

oder

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

2

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

5

oder

10

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

15

R⁶ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR⁷R⁸;

R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R⁸ C₁-C₄-Alkyl;

20

X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴;

25

R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl oder CONR⁷R⁸;

30

oder

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

35

40

R¹⁵ ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der Formel II

45

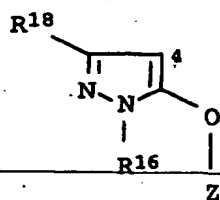
BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

11 08.01.93

3



II

5

Z

wobei

10

R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl;Z H oder SO₂R¹⁷;

15

R¹⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, Phenyl oder Phenyl das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

20

R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl

bedeuten;

25

wobei X und Y nicht gleichzeitig für Sauerstoff oder Schwefel stehen;

und

30

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und 4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol;

40

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach Anspruch 1, wobei R³ Wasserstoff bedeutet.

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

N 08.01.98

4

3. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 oder 2, wobei

5 R^1, R^2 Nitro, Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl;

10

bedeuten.

4. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3, wobei Z für SO_2R^{17} steht.

15

5. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3, wobei Z für Wasserstoff steht.

20

6. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5, wobei X für Sauerstoff und Y für $CR^{13}R^{14}$ stehen.

25

7. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 6, wobei

30

R^4 Halogen, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Cyanoalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-amino, COR^6 , Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy;

35

40

R^5 Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;

oder

45

R^4 und R^5 bilden gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen ge-

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

5

gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

5

R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

10

bedeuten.

8. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 bis 7, wobei

15

R⁴ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;

20

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

25

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

30

oder

R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

35

bedeuten.

40 9. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 6, wobei R⁴ und R⁵ für Wasserstoff stehen.

45 10. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 6 oder 9, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

6

11. 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-pyrazol.

5 12. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5, wobei

X S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

oder

10

Y O, S, NR¹² oder CO;

bedeuten.

15 13. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 12, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

20 14. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 12, wobei

25 R⁴ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
30 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

35

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

40 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

45

oder

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 08.01.98

7

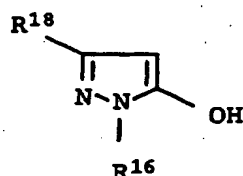
5 R^4 und R^9 oder R^4 und R^{10} oder R^5 und R^{12} oder R^5 und R^{13} bilden gemeinsam eine C_2-C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1-C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

R^{18} C_1-C_6 -Alkyl;

10 bedeuten.

15 15. Verfahren zur Herstellung von 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man das Pyrazol der Formel II mit $Z = H$, wobei die Variablen R^{16} und R^{18} die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

20

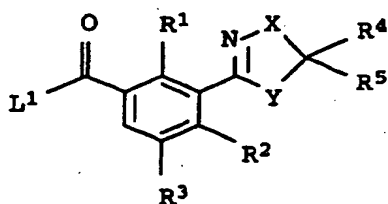


II (mit $Z = H$)

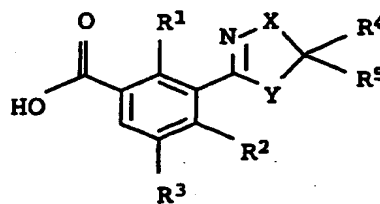
25

mit einer aktivierten Carbonsäure III α oder mit einer Carbonsäure III β ,

30



III α



III β

35

40 wobei die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungsprodukt, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, zu den Verbindungen I (mit $Z = H$) umlagert und gewünschtenfalls zur Herstellung von 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I mit $Z = SO_2R^{17}$ mit einer Verbindung der Formel V,

45

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

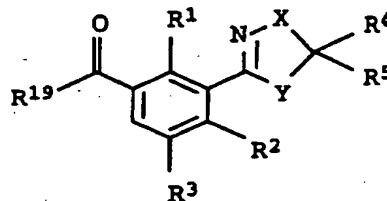
11.08.01.98

8



5 wobei R^{17} die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung hat und L^2
für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, um-
setzt.

16. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoessäurederivate der Formel
III,



III

20 wobei R^{19} für Hydroxy oder einen abhydrolysierbaren Rest steht
und die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter den Ansprüchen
1 bis 14 genannte Bedeutung haben, mit Ausnahme von
25 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoe-
säuremethylester und 2-Chlor-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-4-me-
thylsulfonylbenzoessäuremethylester.

17. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoessäurederivate der Formel
III nach Anspruch 16, wobei

30 R^{19} Halogen, Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkoxy

bedeutet.

35 18. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens
eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivats der For-
mel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I
gemäß den Ansprüchen 1 bis 14, und für die Formulierung von
Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

40 19. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 18, da-
durch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge
mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderi-
vats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren
45 Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 14 und für die Formu-
lierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.

BASF Aktiengesellschaft

960970

O.Z. 0050/47679

M 03.01.99

9

20. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 14, auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.

21. Verwendung der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderviate der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß den Ansprüchen 1 bis 14 als Herbizide.

15

20

25

30

35

40

45

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:**

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.